

(11)Publication number:

2002-308857

(43) Date of publication of application: 23.10.2002

(51)Int.CI.

C07D261/10 A01N 43/80 A01N 43/828 A01N 43/836 A01N 47/16 A01N 47/38 C07D261/08 C07D413/12 C07D417/12

(21)Application number: 2001-215942

(71)Applicant: KUMIAI CHEM IND CO LTD

IHARA CHEM IND CO LTD

(22)Date of filing:

16.07.2001

(72)Inventor: NAKATANI MASAHISA

KUGO RYOTARO MIYAZAKI MASAHIRO

SUMI KOICHIRO FUJINAMI SHU UENO RYOHEI

TAKAHASHI SATOSHI

(30)Priority

Priority number: 2001031784

Priority date: 08.02.2001

Priority country: JP

(54) ISOXAZOLINE DERIVATIVE AND WEED-KILLER CONTAINING THE SAME AS ACTIVE COMPONENT

(57) Abstract:

PROBLEM TO BE SOLVED: To provide an isoxazoline derivative which is excellent in weeding effect and in capability for selecting crops from weeds.

SOLUTION: This isoxazoline derivative is represented by formula [I] (wherein R1 and R2 are each an alkyl; R3, R4, R5, and R6 are each H; Y is an optionally substituted, 5- or 6-membered, aromatic heterocyclic or aromatic fused heterocyclic group having a heteroatom selected from among N, O, and S; and n is 0, 1 or 2).

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

Copyright (C); 1998,2003 Japan Patent Office

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開發号

特開2002-308857 (P2002-308857A)

(43)公開日 平成14年10月23日(2002.10.23)

(51) Int.CL?		識別配号		FΙ			7	~?!!~)*(参考)
C07D2	261/10			C07	D 261/10			4C056
A01N	43/80	101		A01	N 43/80		101	4C063
	43/828				43/90		103	4H011
	43/836				47/16		2	
	43/90	103			47/38		В	
			密查查索	未商求	請求項の数19	OL	(全 188 頁)	最終質に続く

(21)出顧番号 特職2001-21594X P2001-215942)

(22)出題日 平成13年7月16日(2001.7.16)

(31)優先構主張番号 特額2001-31784(P2001-31784) (32)優先日 平成13年2月8日(2001.2.8)

(33)優先權主張国 日本 (JP)

(71)出庭人 000000169

クミアイ化学工業株式会社 東京都台京区池之端1丁目4番26号

(71) 出顧人 000102049

イハラケミカル工業権式会社 東京都台東区池之端1丁目4番26号

(72) 発明者 中谷 昌央

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72) 発明者 久語 良太郎

大阪府県南市岡田 5 丁目27 番池の23

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 イソオキサゾリン誘導体及びこれを有効成分とする除草剤

(57)【要約】

【課題】 本発明は、優れた除草効果と作物・雑草間の選択性を有するイソオキサゾリン誘導体を提供することを 課題とする。

【解決手段】本発明のイソオキサゾリン誘導体は、一般式

(K1)

[式中、R*及びR*は、同一又は異なって、アルキル基を示し、R*, R*, R*, R*は、水素原子を示し、Yは窒素原子、酸素原子及び確貴原子より選択される任意のヘテロ原子を有する5~6員の置換されていてもよい芳香族ヘテロ環華又は芳香族ヘテロ縮合環基を示し、nは0~2の整数を示す。]で表される。

20

特闘2002-308857

【特許請求の範囲】

【韻求項1】一般式 [I] を有するイソオキサゾリン誘 導体又はその薬理上許容される塩:

[(1:1]

$$R^{1} \xrightarrow{R^{2}} R^{3} \xrightarrow{R^{4}} R^{6} \xrightarrow{R^{0}} S(0)_{\overline{a}} \xrightarrow{C} Y \qquad [1]$$

式中.

R'及びR'は、同一又は異なって、水素原子、C1~C1 0アルキル基、C3~C8ンクロアルキル基又はC3~C8 シクロアルキルC1~C3アルキル基を示すか、或いはR "とR"とが一緒になって、これらの結合した炭素原子と 共にC3〜C7のスピロ礫を示し、

R'及びR'は、同一又は異なって、水素原子、C1~C1 9アルキル基又はC3~C8シクロアルキル基を示すか。 或いはR'とR'とが一緒になって、これらの結合した炭 素原子と共にC3~C7のスピロ環を示し、さらにR1. R'、R'及びR'はこれらの結合した炭素原子と共に5 ~8員環を形成することもでき、

R'及びR'は、同一又は钼異なって、水素原子又はC1 ~C10アルキル墓を示し、

Yは窒素原子、酸素原子及び硫貴原子より選択される任 意のヘテロ原子を有する5~6頁の芳香族ヘテロ原基又 は芳香族へテロ福台環基を示し、これらのヘテロ環基は 置換基群々より選択される。()~6個の同一又は相異な る墓で置換されていてもよく、又、隣接したアルキル基 同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ基、 アルキル基とアルキルチオ墓、アルキル基とアルキルス 30 で、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェ ルホニル基、アルキル基とモノアルキルアミノ墓又はア ルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1~4個 のハロゲン原子で置換されてもよい5~8 真環を形成さ れていてもよく、又、これらのヘテロ環基のヘテロ原子 が窒素原子の時は酸化されてN-オキシドになってもよ ۲.

nは0~2の整数を示す。

「置換基欝α」水酸基、チオール基、ハロゲン原子、C 1~С10アルキル基、置換基群とより選択される任意の 基でモノ置換されたC1~C10アルキル基。C1~C4ハ ロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C1~C19 アルコキシ基。置換基群でより選択される任意の基でも ノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロア ルコキシ基、C3~C8シクロアルキルオキシ基、C3~ C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ墓、C1~C 10アルキルチオ墓、置換墓群γより選択される任意の基 でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基、C1~C4 ハロアルキルチオ基、C2~C6アルケニル基、C2~C6 アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6

基。置換基群でより選択される任意の基でモノ置換され たC1~C16アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキ ルスルホニル基、置換基群でより選択される任意の基で モノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~ C4ハロアルキルスルフィニル芸、置換基群でより選択 される任意の基でモノ置換されたC1~C1Gアルキルス ルホニルオキシ基、C1~C4ハロアルキルスルホニル 基、C1~C10アルキルスルホニルオキシ基、C1~C4 ハロアルキルスルホニルオキシ基、置換されていてもよ 10 いフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置 換されていてもよいフェニルチオ基、置換されていても よい芳香族へテロ環基、置換されていてもよい芳香族へ テロ環オキシ華、置換されていてもよい芳香族へテロ環 チオ基、置換されていてもよいフェニルスルフィニル 基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換 されていてもよい芳香族へテロ環スルホニル基。置換さ れていてもよいフェニルスルホニルオキシ基、アシル 基。C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されてい てもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよい ベンゾイル基。カルボキシル基、C1~C10アルコキシ カルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカ ルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニ ル基、シアノ基、カルバモイル基(酸基の窒素原子は同 一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されて いてもよいフェニル基で置換されていてもよい。)、C 1~C6アシルオキシ基、C1~C4ハロアルキルカルボニ ルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニル オキシ基、置換されていてもよいベンゾイルオキシ基、 ニトロ基、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なっ ニル基、C1~C6アシル基。C1~C4ハロアルキルカル ボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル 基、置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10ア ルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル 基、置換されていてもよいベンジルスルホニル甚又は農 換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されて いてもよい。)

「置換基群 B」水酸基、C3~C8シクロアルキル基(該 基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよ 40 い). C1~C10アルコキシ基. C1~C10アルキルチオ 基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C10アルコ キンカルボニル基、C2~C6パロアルケニル基。アミノ 基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10ア ルキル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカ ルボニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C 4)ロアルキルスルホニル基で置換されていてもよ い)、カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異な って、C1~C10アルキル基で置換されていてもよ い)、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボ アルキニルオキシ基、C1~C10アルキルスルフィニル 50 ニル基、C1~C10アルコキシイミノ基、シアノ基、置

特闘2002-308857

換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい フェノキシ基

「置換基群 Y」C1~C10アルコキシカルボニル基、置 換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい 芳香族へテロ環苗、シアノ基、カルバモイル基(該基の 窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で 置換されていてもよい。)

【調水項2】0~6個の同一又は相異なる基で置換され ていてもよいヘテロ環上の置換基群αが水酸基。ハロゲ ン原子、C1~C16アルキル基。置換基群&より選択さ れる任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基。 C1~C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、 C1~C10アルコキシ基、置換基群ャより選択される任 意の基でモノ窗換されたC1~C10アルコキシ基、C1~ C4ハロアルコキシ墓、C3~C8シクロアルキルオキシ 基.C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ 基。C1~C10アルキルチオ基、置換基群でより選択さ れる任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ 基、C1~C4ハロアルキルチオ基、C2~C6アルケニル 基. C2~C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル 20 基、C2~C6アルキニルオキシ基、C1~C1Gアルキル スルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置 換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい フェノキシ基、置換されていてもよいフェニルチオ基、 置換されていてもよい芳香族へテロ類基、置換されてい てもよい芳香族ヘテロ環オキシ基、置換されていてもよ い芳香族へテロ環チオ基、置換されていてもよいフェニ ルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族へテロ環 スルホニル基。C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキ ルカルボニル芸、置換されていてもよいペンジルカルボ 30 求項6記載のイソオキサゾリン誘導体。 ニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、カルボキ シル基、C1~C10アルコキシカルボニル基。シアノ 基。カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なっ て、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフ ェニル基で置換されていてもよい。) ニトロ基 アミ ノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10 アルキル基、置換されていてもよいフェニル基。C1~ C5アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置 換されていてもよいペンジルカルボニル基、置換されて いてもよいベンゾイル基.C1~C10アルキルスルホニ ル基。C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されて いてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていても よいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい。〉 であるか、或いは隣接したアルキル基同士、アルコキシ 基同士、アルキル基とアルコキシ基。アルキル基とアル キルチオ基、アルキル基とアルキルスルホニル基。アル キル苺とモノアルキルアミノ基又はアルキル基とジアル キルアミノ基が2個結合して1~4個のハロゲン原子で 置換されてもよい5~8員環を形成されていてもよい請 **求項1記載のイソオキサゾリン誘導体。**

【請求項3】()~6個の同一又は相異なる基で置換され ていてもよいヘテロ環上の置換基群々がハロゲン原子、 C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル基、C1~ C10アルコキシC1~C3アルキル基、C3~C8シクロア ルキル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換さ れてもよい). C1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロ アルコキシ基、C3~C8ンクロアルキルC1~C3アルキ ルオキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基、C1 ~C16アルキルチオ基、C1~C16アルキルスルホニル 10 基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C 1~010アルコキシカルボニル苗、シアノ苗又はカルバ モイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってC1~C1 0アルキル基で置換されていてもよい)である請求項2 記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項4】R1及びR1が、同一又は異なってメチル基 もしくはエチル基、R'、R'、R'及びR'が水素原子で ある誤求項1. 2又は3記載のイソオキサゾリン誘導

【請求項5】 Yが窒素原子、酸素原子及び硫費原子より 選択される任意のヘテロ原子を有する5員環又は6員環 の芳香族へテロ環基である間求項1.2、3又は4記載 のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項6】Yがチエニル基、ピラゾリル基、イソキサ ゾリル基、イソチアゾリル基、ピリジル基又はピリミジ ニル基である請求項5記載のイソオキサゾリン誘導体。 【韻求項7】Yがチオフェンー3-イル基、ピラゾール -4-イル基。ピラゾール-5-イル基、イソオキサゾ ールー4-イル墓、イソチアゾール-4-イル墓。ピリ ジン・3-イル基又はピリミジン-5-イル基である請

【記求項8】Yがチオフェン-3-イル基で、置換基群 αがチオフェン頃の2及び4位に必ず置換した請求項7 記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項9】 Yがピラゾールー4ーイル基で、置換基群 αがピラゾール環の3及び5位に、さらに1位に水素原 子、C1~C10アルキル基、置換基群&より選択される 任意の基でモノ面換されたC1~C10アルキル基、C1~ C4ハロアルキル基、C3~C8ンクロアルキル基、C2~ C6アルケニル基、C2~C6アルキニル基。C1~C10ア ルキルスルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル 基、置換基群でより選択される任意の基でモノ置換され たC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアル キルスルホニル芸、置換されていてもよいフェニル基、 置換されていてもよい芳香族へテロ環基、置換されてい てもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい 芳香族へテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4いロ アルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジル カルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C 1~С10アルコキシカルボニル甚、置換されていてもよ 50 いベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよい (4)

б

フェノキシカルボニル基。カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよい)。アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基。置換されていてもよいフェニル基。アシル基。C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンジイル基。C1~C10アルキルスルホニル基。C1~C4ハロアルキルスルホニル基。置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていてもよい、が必ず層像した語求項7記載のイソオキサゾリン誘導体

必ず置換した調求項7記載のイソオキサゾリン誘導体 【韻求項10】Yがピラゾールー5-イル基で、置換基 群αがピラゾール環の4位に、さらに1位に水素原子、 C1~C10アルキル基、置換基群Bより選択される任意 の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基。C1~C4 ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C2~C5 アルケニル基。C2~C6アルキニル基。C1~C10アル キルスルフィニル基、C1~C1Gアルキルスルホニル 基、置換基群でより選択される任意の基でモノ置換され 20 たC1~C10アルキルスルホニル基、C1~C4ハロアル キルスルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、 置換されていてもよい芳香族へテロ環基、置換されてい てもよいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい 芳香族へテロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4vロ アルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジル カルボニル基、置換されていてもよいベンゾイル基、C 1~ C 10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよ いベンジルオキシカルボニル基、置換されていてもよい フェノキシカルボニル基。カルバモイル基(該基の窒素 30 原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置 換されていてもよいフェニル基で置換されていてもよ い)、アミノ蟇(該基の窒素原子は同一又は異なって、 C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル 基、アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置 換されていてもよいベンジルカルボニル基、置換されて いてもよいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニ ル墓。C1~C4ハロアルキルスルポニル基、置換されて いてもよいベンジルスルホニル基又は置換されていても よいフェニルスルホニル基で置換されていてもよい)が 40 必ず置換した請求項で記載のイソオキサゾリン誘導体。 【詰求項11】Yがイソオキサゾール-4-イル墓で、

【請求項11】 Υ かイソオキサソール - 4 - イル基で、 置換基解αがイソオキサゾール環の3位及び5位に必ず 置換した請求項?記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項12】 Υがイソチアゾール-4-イル基で、置 換基群αがイソチアゾール環の3位及び5位に必ず置換 した請求項7記載のイソオキサゾリン誘導体。

【請求項13】Yがピリジン-3-イル基で、面換基群 αがピリジン環の2位及び4位に必ず面換した請求項7 記載のイソオキサゾリン誘導体。

【詰求項14】Yがピリミジンー5-イル基で、 面換基 群々がピリミジン環の4位及び6位に必ず置換した請求 項7記載のイソオキサゾリン誘導体。

【 請求項 15 】 nが2の整数である 請求項 1~14のいずれかに記載のインオキサゾリン誘導体。

【請求項16】nが1の整数である請求項のいずれかに 1~14記載のインオキサゾリン誘導体。

【詰求項17】 nが0の整数である詰求項のいずれかに 1~14記載のインオキサゾリン誘導体。

【 請求項 1 8 】 請求項 1 ~ 1 7 のいずれかに記載のイソ オキサゾリン誘導体又は薬理上許容される塩を有効成分 として含有する除草剤。

【請求項19】請求項16及び請求項17に記載のイソオキサゾリン誘導体又は、請求項15に記載のイソオキサゾリン誘導体の製造中間体。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【産業上の利用分野】 本発明は新規なイソオキサゾリン 誘導体及びそれを有効成分として含有する除草剤に関す るものである。

[0002]

【従来の技術】イソオキサゾリン誘導体が除草活性を有することは、例えば、特開平8-22558号公報明細書、特開平9-328477号公報明細書及び特開平9-328483号公報明細書等に報告されている。しかしながら本発明化合物はこれらの文献に記載されていない。

[0003]

【発明が解決しようとする課題】有用作物に対して使用される除草剤は、土壌または茎葉に施用し、低薬量で十分な除草効果を示し、しかも作物・雑草間に高い選択性を発揮する菜剤であることが望まれる。これらの点で、当該の公報明細書に記載の化台物は必ずしも満足すべきものとは言い難い。

[0004]

【課題を解決するための手段】 本発明者らはこの様な状況に臨み、除草効果と作物・維草間の選択性を検討した 結果、新規なイソオキサゾリン誘導体が、優れた除草効 果と作物・維草間の選択性を有することを見いだし、本 発明を完成するに至った。

0 【0005】即ち、本発明は

(1) 一般式 [1] を有するイソオキサゾリン誘導体又はその榮理上許容される塩:

[0006]

[ft2]

0 【0007】式中、R'及びR'は、同一又は具なって、

2/16/2005

特闘2002-308857

水素原子、C1~C10アルキル基。C3~C8シクロアル キル華又はC3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル基 を示すか、或いはR'とR'とが一緒になって、これらの 結合した炭素原子と共にC3~C2のスピロ環を示し、R '及びR'は、同一又は異なって、水素原子、C1~C10 アルキル基又はC3~C8ンクロアルキル基を示すが、政 いはR'とR'とが一緒になって、これらの結合した炭素 原子と共に03~07のスピロ環を示し、さらにR1、 Ri、Ri及びRiはこれらの結合した炭素原子と共に5 ~8員職を形成することもでき、R'及びR'は、同一又 10 は相異なって、水素原子又はC1~C10アルキル基を示 し、Yは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択され る任意のヘテロ原子を有する5~6員の芳香族ヘテロ環 基又は芳香族へテロ縮合環基を示し、これらのヘテロ環 基は置換基群αより選択される。0~6個の同一又は相 異なる基で置換されていてもよく、又、隣接したアルキ ル基同士、アルコキシ基同士、アルキル基とアルコキシ 基。アルキル基とアルキルチオ基、アルキル基とアルキ ルスルホニル基。アルキル基とモノアルキルアミノ基又 はアルキル基とジアルキルアミノ基が2個結合して1~ 20 基。 置換されていてもよいベンゾイル基、C1~C10ア 4個のハロゲン原子で置換されてもよい5~8員環を形 成されていてもよく、又、これらのヘテロ環基のヘテロ 原子が窒素原子の時は酸化されてN-オキシドになって もよく、nは0~2の整数を示す。

「置換基群a」水酸基、チオール基、ハロゲン原子、C 1~C10アルキル基、置換基群&より選択される任意の 基でモノ置換されたC1~C10アルキル基。C1~C4小 ロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C1~C10 アルコキシ基、置換基群でより選択される任意の基でも ノ置換されたC1~C10アルコキシ基、C1~C4ハロア ルコキシ基、C3~C8シクロアルキルオキシ基、C3~ C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基、C1~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意の基 でモノ置換されたC1~C10アルキルチオ基。C1~C4 ハロアルキルチオ基、C2~C5アルケニル基、C2~C6 アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~C6 アルキニルオキシ基、C1~C10アルキルスルフィニル 基、置換基群でより選択される任意の基でモノ置換され たC1~C10アルキルスルフィニル基、C1~C10アルキ ルスルホニル華、置換基群でより選択される任意の基で 40 モノ置換されたC1~C10アルキルスルホニル基、C1~ C4ハロアルキルスルフィニル番、置換基群でより選択 される任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキルス ルホニルオキシ基、C1~C4ハロアルキルスルホニル 基. C1~C10アルキルスルホニルオキシ基. C1~C4 ハロアルキルスルホニルオキシ基、置換されていてもよ いフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ基、置 換されていてもよいフェニルチオ基、 置換されていても よい芳香族ヘテロ環基、置換されていてもよい芳香族へ テロ環オキシ芸、置換されていてもよい芳香族へテロ環 50 C10アルコキシ芸、置換芸群γより選択される任意の基

チオ基、置換されていてもよいフェニルスルフィニル 基、置換されていてもよいフェニルスルホニル基、置換 されていてもよい芳香族へテロ環スルホニル基、置換さ れていてもよいフェニルスルホニルオキシ基、アシル 基。C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換されてい てもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよい ベンゾイル基。カルボキシル基、C1~C16アルコキシ カルボニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカ ルボニル基、置換されていてもよいフェノキシカルボニ ル基、シアノ基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同 一又は異なって、C1~C10アルキル基又は置換されて いてもよいフェニル基で置換されていてもよい。)、〇 1~C6アシルオキシ基、C1~C4ハロアルキルカルボニ ルオキシ基、置換されていてもよいベンジルカルボニル オキシ基、置換されていてもよいベンゾイルオキシ基、 ニトロ基、アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なっ て、C1~C10アルキル基、置換されていてもよいフェ ニル基、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカル ボニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル ルキルスルホニル基、C1~C4ハロアルキルスルホニル 基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置 換されていてもよいフェニルスルホニル基で置換されて いてもよい。)

「置換基群8」水酸基、C3~C8シクロアルキル基(該 基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されてもよ い)、C1~C10アルコキシ基、C1~C10アルキルチオ 基. C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C10アルコ キシカルボニル墓、C2~C6パロアルケニル基。アミノ 30 基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C10ア ルキル基、C1~C5アシル基、C1~C4ハロアルキルカ ルボニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、C1~C 4ハロアルキルスルホニル基で置換されていてもよ い)カルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異な って、C1~C10アルキル基で置換されていてもよ い)、C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボ ニル基、C1~C10アルコキシイミノ基、シアノ基、置 換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい フェノキシ基

「置換基群ャ」C1~C10アルコキシカルボニル基、置 換されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい 芳香族へテロ環基、シアノ基、カルバモイル基(酸基の 窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基で 置換されていてもよい。)

(2) 0~6個の同一又は相異なる基で置換されていて もよいヘテロ環上の置換差群なが水酸差、ハロゲン原 子、C1~C10アルキル基、置換基群βより選択される 任意の基でモノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~ C4ハロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C1~

10

でそノ置換されたC1~C10アルコキシ基。C1~C4ハ ロアルコキシ蟇、C3~C8シクロアルキルオキシ蟇、C 3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオキシ基。C1 ~C10アルキルチオ基、置換基群γより選択される任意 の基でモノ農換されたC1~C10アルキルチオ基、C1~ C4ハロアルキルチオ華、C2~C6アルケニル基、C2~ C6アルケニルオキシ基、C2~C6アルキニル基、C2~ C5アルキニルオキシ基、C1~C1Gアルキルスルホニル 基。C1~C4ハロアルキルスルホニル基、置換されてい てもよいフェニル基、置換されていてもよいフェノキシ 10 基、置換されていてもよいフェニルチオ基、置換されて いてもよい芳香族へテロ環基、置換されていてもよい芳 香族へテロ環オキシ基、置換されていてもよい芳香族へ テロ環チオ基、置換されていてもよいフェニルスルホニ ル基、置換されていてもよい芳香族へテロ環スルホニル 基。C1~C6アシル基、C1~C4ハロアルキルカルボニ ル基、置換されていてもよいペンジルカルボニル基、置 換されていてもよいベンゾイル基、カルボキシル基、C 1~010アルコキシカルボニル芸。シアノ墓。カルバモ イル基 (該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C1 20 0アルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置 換されていてもよい。)、ニトロ基、アミノ基(該基の 窒素原子は同一又は異なって、C1~C10アルキル基。 置換されていてもよいフェニル基、C1~C5アシル基、 C1~C4ハロアルキルカルボニル基。 置換されていても よいベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベン ゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基。C1~C4 ハロアルキルスルホニル基、置換されていてもよいベン ジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニルス 隣接したアルキル基同士。アルコキシ基同士、アルキル 基とアルコキシ基、アルキル基とアルキルチオ基、アル キル蟇とアルキルスルホニル基、アルキル基とモノアル キルアミノ基又はアルキル墓とジアルキルアミノ墓が2 個結合して1~4個のハロゲン原子で置換されてもよい 5~8 具環を形成されていてもよい(1) に記載のイソ

オキサゾリン誘導体。 (3)()~6個の同一又は祖異なる墓で置換されていて もよいヘテロ環上の置換基群αがハロゲン原子。C1~ C10アルキル基。C1~C4ハロアルキル基、C1~C10 アルコキシC1~C3アルキル基、C3~C8シクロアルキ ル基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されて もよい)、C1~C10アルコキシ蟇、C1~C4ハロアル コキシ基、C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキルオ キシ苺、置換されていてもよいフェノキシ基、C1~C1 6アルキルチオ基、C1~C16アルキルスルホニル基、ア シル基、C1~C4\ロアルキルカルボニル基、C1~C1 6アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイル 基(該基の窒素原子は同一又は異なってC1~C10アル キル基で置換されていてもよい)である(2)に記載の 50 (10)Yがビラゾール-5-イル甚で、置換基群αが

イソオキサゾリン誘導体。

(4) R*及びR*が、同一又は異なってメチル番もしく はエチル基、R1、R1、R1及びR0が水素原子である (1)、(2)又は(3)に記載のイソオキサゾリン誘 遵体。

(5) Yが窒素原子、酸素原子及び硫黄原子より選択さ れる任意のヘテロ原子を有する5月環又は6月頃の芳香 族へテロ環基である(1).(2).(3)又は(4) に記載のイソオキサゾリン誘導体。

(6) Yがチエニル基、ピラゾリル基、インキサゾリル 基。イソチアゾリル基、ピリジル基又はピリミジニル基 である(5)に記載のイソオキサゾリン誘導体。

(?) Yがチオフェン-3-イル基。ピラゾール-4-イル基、ピラゾールー5ーイル基、イソオキサゾールー 4-イル基、イソチアゾールー4-イル基、ピリジンー 3-イル基又はビリミジン-5-イル基である(6)に 記載のイソオキサゾリン誘導体。

(8) Yがチオフェン-3-イル基で、置換基群々がチ オフェン環の2及び4位に必ず置換した(7)に記載の イソオキサゾリン誘導体。

(9) Yがビラゾールー4-イル基で、置換基群ながビ ラゾール環の3及び5位に、さらに1位に水素原子、C 1~010アルキル基。 固換基群のより選択される任意の 基でモノ置換されたC1~C10アルキル基。C1~C4小 ロアルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C2~C6ア ルケニル基、C2~C6Pルキニル基。C1~C10Pルキ ルスルフィニル墓、C1~C10アルキルスルホニル基。 置換基群γより選択される任意の基でモノ置換されたC 1~C10アルキルスルホニル基。C1~C4ハロアルキル ルホニル基で置換されていてもよい。) であるか或いは 30 スルホニル基。置換されていてもよいフェニル基。置換 されていてもよい芳香族へテロ環基、置換されていても よいフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香 族へテロ環スルホニル基。アシル基。C1~C4ハロアル キルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカル ボニル基、置換されていてもよいペンゾイル基。C1~ C10アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいべ ンジルオキシカルボニル芸、置換されていてもよいフェ ノキシカルボニル基、カルバモイル基(該基の窒素原子 は同一又は異なって、C1~C10アルキル甚又は置換さ 40 れていてもよいフェニル基で置換されていてもよい)、 アミノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~ C10アルキル基、置換されていてもよいフェニル基、ア シル基、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、置換され ていてもよいベンジルカルボニル基、置換されていても よいベンゾイル基、C1~C10アルキルスルホニル基。 C1~C4ハロアルキルスルホニル基 置換されていても よいベンジルスルホニル益又は置換されていてもよいフ ェニルスルホニル基で置換されていてもよい) が必ず置 **換した(7)に記載のイソオキサゾリン誘導体**

ピラゾール環の4位に、さらに1位に水素原子。C1~ C10アルキル芸、置換基群&より選択される任意の基で モノ置換されたC1~C10アルキル基、C1~C4ハロア ルキル基、C3~C8シクロアルキル基、C2~C6アルケ ニル基、C2~C6アルキニル基、C1~C16アルキルス ルフィニル基、C1~C10アルキルスルホニル基、置換 基群でより選択される任意の基でモノ置換されたC1~ C10アルキルスルホニル基。C1~C4ハロアルキルスル ホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換され ていてもよい芳香族へテロ環基、置換されていてもよい 10 フェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族へ テロ環スルホニル基、アシル基、C1~C4ハロアルキル カルボニル基。置換されていてもよいベンジルカルボニ ル基、置換されていてもよいペンゾイル基、C1~C10 アルコキシカルボニル基、置換されていてもよいベンジ ルオキシカルボニル基、置換されていてもよいフェノキ シカルボニル基、カルバモイル基(該基の窒素原子は同 一又は異なって、C1~C10アルキル基又は箇換されて いてもよいフェニル基で置換されていてもよい)。 アミ アルキル基、置換されていてもよいフェニル基。アシル 基。C1~C4ハロアルキルカルボニル基、避換されてい てもよいベンジルカルボニル基、置換されていてもよい ベンゾイル基。C1~C10アルキルスルホニル基、C1~ C4ハロアルキルスルホニル基。 置換されていてもよい ベンジルスルホニル基又は置換されていてもよいフェニ ルスルホニル基で置換されていてもよい)が必ず置換し た(7)に記載のイソオキサゾリン誘導体。

11

- (11) Yがイソオキサゾールー4-イル基で、 窗換基 群αがイソオキサゾール環の3位及び5位に必ず置換し 30 た(7)記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (12) Yがイソチアゾールー4-イル基で、置換基群 αがイソチアゾール環の3位及び5位に必ず置換した。 (7)記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (13) Yがビリジン-3-イル基で、置換基群αがビ リジン環の2位及び4位に必ず置換した(7)記載のイ ソオキサゾリン誘導体。
- (14) Yがビリミジン-5-イル基で、遺換差群なが ピリミジン環の4位及び6位に必ず置換した(7)記載 のイソオキサゾリン誘導体。
- (15) nが2の整数である(1)~(14)のいずれ かに記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (16) nが1の整数である(1)~(14)のいずれ かに記載のイソオキザゾリン誘導体。
- (17) nが0の整数である(1)~(14)のいずれ かに記載のイソオキサゾリン誘導体。
- (18) (1) ~ (17) のいずれかに記載のイソオキ サゾリン誘導体又は薬理上許容される塩を有効成分とし て含有する除草剤。

ン誘導体又は、(15)に記載のイソオキサゾリン誘導 体の製造中間体。

【0008】尚、本明細書において、用いちれる用語の 定義を以下に示す。

【0009】C1~C10等の表記は、この場合ではこれ に続く置換基の炭素数が、1~10であることを示して いる。

【0010】ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原 子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

【0011】C1~C16アルキル蟇とは、特に限定しな い限り、炭素数が1~10の直鎖又は分岐鎖状のアルキ ル墓を示し、例えばメチル墓、エチル墓、n-プロピル 基。イソプロビル基、n-ブチル基。イソブチル基、se cーブチル基、tertーブチル基。nーペンチル基、イソ ペンチル基、ネオペンチル基、カーヘキシル基、イソヘ キシル基、3,3-ジメチルブチル基、ヘブチル基、又 はオクチル基等を挙げることができる。

【①①12】 ○3~ ○8ンクロアルキル基とは、炭素数が 3~8のシクロアルキル基を示し、例えばシクロプロピ ノ基(該基の窒素原子は同一又は異なって、C1~C16 20 ル基。シクロブチル基、シクロペンチル基、又はシクロ ヘキシル基等を挙げることができる。

> 【0013】C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル 基(該基はハロゲン原子又はアルキル基で置換されても よい)とは、特に限定しない限り同一又は異なって、ハ ロゲン原子1~4又はC1~C3アルキル基で置換されて もよいC3~C8シクロアルキル基により置換されたC1 ~03アルキル基を示し、例えばシクロプロビルメチル 基、1-シクロプロビルエチル基、2-シクロプロビル エチル基、1-シクロプロピルプロピル基、2-シクロ - プロビルプロビル基、3-シクロプロビルプロビル基、 シクロブチルメチル基、シクロペンチルメチル基。シク ロヘキシルメチル基2-クロロシクロプロピルメチル 基.2,2ージクロロシクロプロビルメチル基、2ープ ルオロシクロプロピルメチル基、2,2-ジフルオロシ クロプロピルメチル基、2-メチルシクロプロピルメチ ル華、2,2-ジメチルシクロプロピルメチル基、又は 2-メチルシクロプロピルエチル基等を挙げるととがで

【①①14】C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル 40 基とは、炭素数が3~8のシクロアルキル基により置換 された炭素数1~3のアルキル基を示し、例えばシクロ プロビルメチル苺、1-シクロプロビルエチル苺、2-シクロプロピルエチル基。 1-シクロプロピルプロピル 基。2-シクロプロピルプロピル基。3-シクロプロピ ルプロピル基、シクロブチルメチル基、シクロペンチル メチル基、又はシクロヘキシルメチル芸等を挙げること ができる。

【0015】C1~C4ハロアルキル基とは、特に限定し ない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1~9で置 (19)(16)及び(17)に記載のイソオキサゾリ 50 換されている炭素数が1~4の直鎖又は分岐鎖のアルキ

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

ル基を示し、例えばフルオロメチル基。クロロメチル 基。プロモメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオ ロメチル基、2.2-ジフルオロエチル基、2.2.2-トリフルオロエチル基、又はペンタフルオロエチル基等 を挙げることができる。

【0016】C2~C6アルケニル基とは、炭素敷が2~ 6の直鎖又は分岐鎖のアルケニル基を示し、例えばエテ ニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、イソプ ロペニル基、1-ブテニル基、2-ブテニル基、3-ブ テニル基、又は2-ペンテニル基等を挙げることができ 10 基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)

【0017】C2~C6アルキニル基とは、炭素数が2~ 6の直鎖又は分岐鎖のアルキニル基を示し、例えばエチ エル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニ ル苺、2-ブチニル基、3-ブチニル基、又は2-メチ ルー3-ブチニル基等を挙げることができる。

【0018】C2~C5ハロアルケニル蟇とは、特に限定 しない限り、同一又は異なって、ハロゲン原子1~4で 置換されている炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖のアル ケニル基を示し、例えば3-クロロ-2-プロペニル 基、又は2-クロロー2-プロペニル基等を挙げること ができる。

【0019】C1~C10アルコキシ基とは、アルキル部 分が上記の意味である (アルキル) - 〇-基を示し、例 えばメトキシ蟇。エトキシ蟇、カープロポキシ蟇。イソ プロポキシ基、tertープトキシ基、nープトキシ基、se c-ブトキシ基、又はイソプトキシ基等を挙げることが できる。

【0020】C1~C4ハロアルコキシ蟇とは、ハロアル を示し、例えばジフルオロメトキシ墓。トリフルオロメ トキシ基、2,2-ジフルオロエトキシ基、又は2,2, 2-トリフルオロエトキシ基等を挙げることができる。 【0021】C3~C8シクロアルキルオキシ基とは、シ クロアルキル部分が上記の意味である (シクロアルキ ル)一〇一基を示し、例えばシクロプロピルオキジ基、 シクロブチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、又は シクロヘキシルオキシ基等を挙げるととができる。

【0022】C3~C8シクロアルキルC1~C3アルキル オキシ基とは、シクロアルキルアルキル部分が上記の意 40 味である(シクロアルキルアルキル)-〇-基を示し、 例えばシクロプロビルメトキシ基、1-シクロプロビル エトキシ基、2-シクロプロビルエトキシ基、1-シク ロプロビルプロポキシ基。2-シクロプロビルプロポキ シ蟇、3-シクロプロピルプロポキシ蟇、シクロブチル メトキシ基、シクロペンチルメトキシ基、又はシクロへ キシルストキシ基等を挙げることができる。

【0023】C2~C5アルケニルオキシ基及びC2~C6 アルキニルオキシ基とは、アルケニル又はアルキニル部 分が上記の意味である(アルケニル)-O-基。(アル 50 部分が上記の意味である(ハロアルキルカルボニル)-

キニル)-〇-墓を示し、倒えば2-プロペニルオキシ 基、又は2-プロピニルオキシ基等を挙げることができ

【0024】C1~C10アルコキシイミノ基とは、アル コキシ部分が上記の意味である(アルコキシ)-N=基 を示し、例えばメトキシイミノ基又はエトキシイミノ基 等を挙げることができる。

【① 0 2 5 】C1~C16アルキルチオ基、C1~C16アル キルスルフィニル基及びC1~C10アルキルスルホニル - S - 基、 (アルキル) - S O - 基。 (アルキル) - S Oz-基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基。 n-プロビルチオ基、イソプロビルチオ基、メチルスル フィニル基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル 基。n-プロビルスルホニル基、又はイソプロビルスル ホニル基等を挙げることができる。

【0026】C1~C10アルキルスルホニルオキシ基と は、アルキルスルホニル部分が上記の意味である(アル キルスルホニル)-〇-基を示し、例えばメチルスルホ 20 ニルオキシ基又はエチルスルホニルオキシ基等を挙げる ことができる。

【0027】C1~C10アルコキシカルボニル基とは、 アルコキシ部分が上記の意味である(アルコキシ)-C O-基を示し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシ カルボニル基。ュープロポキシカルボニル基、又はイソ プロポキシカルボニル基等を挙げるととができる。

【0028】C1~C5アシル基とは、炭素数1~6の直 鎖又は分岐鎖状の脂肪族アシル基を示し、例えばホルミ ル蟇、アセチル基、プロビオニル基、イソプロビオニル キル部分が上記の意味である(ハロアルキル)-〇-基 30 基。ブチリル基。又はピパロイル基等を挙げるととがで

> 【0029】C1~C10アシルオキシ基とは、アシル部 分が上記の意味である(アシル)-〇-基、を示し、例 えばアセトキシ墓、プロビオニルオキシ基、イソプロビ オニルオキシ墓、又はピバロイルオキシ基等を挙げるこ とができる。

【0030】C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1 ~C4ハロアルキルチオ基及びC1~C4ハロアルキルス ルホニル基とは、ハロアルキル部分が上記の意味である **〈ハロアルキル)-CO-苺、〈ハロアルキル)-S-**基、(ハロアルキル)-SO,-基を示し、例えばクロ ロアセチル基。トリフルオロアセチル基、ペンタフルオ ロブロピオニル芸、ジフルオロメチルチオ基、トリフル オロメチルチオ蟇、クロロメチルスルホニル基、ジフル オロメチルスルホニル基。又はトリフルオロメチルスル ホニル基等を挙げることができる。

【0031】C1~C4ハロアルキルカルボニルオキシ基 及びC1~C4ハロアルキルスルホニルオキシ基とは、ハ ロアルキルカルボニル部分及びハロアルキルスルホニル

16

〇一墓、(ハロアルキルスルホニル) -〇一基を示し、 例えばクロロアセチルオキシ基、トリフルオロアセチル オキシ基、クロロメチルスルホニルオキシ基、又はトリ フルオロメチルスルホニルオキシ基等を挙げることがで きる.

15

【0032】(置換されていてもよい)フェニル基、 (置換されていてもよい) 芳香族へテロ環基、(置換さ れていてもよい) フェノキシ基、 (置換されていてもよ い) 芳香族ヘテロ環オキシ蟇、 (置換されていてもよ い)フェニルチオ基、(置換されていてもよい)芳香族 10 ヘテロ環チオ墓、〈置換されていてもよい〉フェニルス ルホニル基、(置換されていてもよい) フェニルスルホ ニルオキシ基。(置換されていてもよい) 芳香族へテロ 環スルホニル墓。 (置換されていてもよい) ベンジルカ ルボニル基、(置換されていてもよい) ベンジルカルボ ニルオキシ基、(置換されていてもよい) ベンジルスル ホニル基、 (置換されていてもよい) ベンゾイル基、 (置換されていてもよい) ベンゾイルオキシ基。(置換 されていてもよい)ベンジルオキシカルボニル華又は **(置換されていてもよい)フェノキシカルボニル基にお 20** ける「鎧換されていてもよい基」とは、例えばハロゲン 原子、C1~C10アルキル基、C1~C4ハロアルキル 基。C1~C10アルコキシアルキル基、C1~C10アルコ キン墓、C1~C10アルキルチオ墓、C1~C10アルキル スルホニル基。アシル基。C1~C10アルコキシカルボ ニル苺、シアノ苺、カルバモイル基(該基の窒素原子は 同一又は異なって、C1~C10アルキル基で置換されて いてもよい)、ニトロ基、又はアミノ基(該基の窒素原 子は同一又は異なって、C1~C16アルキル基、C1~C 6アシル語、C1~C4ハロアルキルカルボニル基、C1~ 30 C16アルキルスルホニル基。又はC1~C4ハロアルキル スルホニル基で置換されていてもよい) 等で置換されて いてもよいことを示す。

【0033】窒素原子、酸素原子及び碱黄原子から任意 に選択されるヘテロ原子を有する5員から6員の芳香族 ヘテロ課基とは、例えばヘテロ原子を1から3個有する フリル基、チエニル基、ピロリル基、ピラゾリル基、イ ソキサゾリル墓、インチアゾリル基、オキサゾリル基、 チアゾリル基。イミダゾリル基、ピリジル基、ピリダジ 基.トリアゾリル基、オキサジアゾリル基又はチアジア ゾリル基を挙げることができる。

【りり34】芳香族へテロ福台環基とは、窒素原子、酸 素原子及び硫黄原子から任意に選択されるヘテロ原子を 1~3個有する甚を示し、例えばベンゾフリル基、ベン ゾチエニル基。インドリル基、ベンゾオキサゾリル基、 ベンゾチアゾリル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾイ ソキサゾリル墓。ベンゾイソチアゾリル基、インダゾリ ル基、キノリル基、イソキノリル基、フサラジニル基、

はベンゾトリアゾリル基を挙げることができる。 【0035】(置換されていてもよい) 芳香族ヘテロ環 基。(置換されていてもよい) 芳香族へテロ環オキシ (置換されていてもよい) 芳香族へテロ環チオ基又 は (置換されていてもよい) 芳香族ヘテロ環スルホニル 基の芳香族へテロ環とは、窒素原子、酸素原子及び硫黄 原子から任意に選択されるヘテロ原子を1~3個有する 5~6員の基を示し、例えばフリル基、チェニル基、ビ ロリル基、ピラゾリル基、インキサゾリル基、インチア ゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、イミダゾリ ル基」ピリジル基、ピリダジニル基」ピリミジニル基、 ピラジニル基。トリアジニル基、トリアゾリル基。オキ サジアゾリル基又はチアジアゾリル基を挙げるととがで ***3.**

【0036】薬理上許容される塩とは、一般式[1]を 有する化合物において、水酸基、カルボキシル基又はア ミノ基等がその構造中に存在する場合に、これらと金屑 もしくは有機塩基との塩又は鉱酸もしくは有機酸との塩 であり、金属としてはナトリウム又はカリウム等のアル カリ金属或いはマグネシウム又はカルシウム等のアルカ リ土類金属を挙げることができ、有機塩基としてはトリ エチルアミン又はジイソプロピルアミン等を挙げること ができ、鉱酸としては塩酸又は硫酸等を挙げることがで き、有機酸としては酢酸、メタンスルホン酸又はカート ルエンスルホン酸等を挙げることができる。

【0037】上記した一般式[1]の中で好ましくは、 R¹及びR¹が、同一又は異なってメチル基又はエチル基 であり、R'、R'、R'及びR'が水素原子であり、n が2の整数であり、Yがチオフェン-3-イル基(ここ で該墓の2位及び4位は、ハロゲン原子、アルキル基、 ハロアルキル基。アルコキシアルキル基、シクロアルキ ル基、アルコキシ基、ハロアルコキシ基、アシル基、ハ ロアルキルカルボニル基。アルコキシカルボニル基、シ アノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は 異なってアルキル基で置換されていてもよい)が必ず置 換する。)、ビラゾール-4-イル基(ここで該基の3 位及び5位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハロアルキ ル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル基、アル コキシ基、ハロアルコキシ基、シクロアルキルアルキル ニル墓、ピリミジニル基。ビラジニル墓、トリアジニル 40 オキシ基、置換されていてもよいフェノキシ基。アルキ ルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル基、ハロアル キルカルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基 又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なっ てアルキル基で置換されていてもよい)が、さらに1位 に水素原子、アルキル基、置換基群Bより選択される任 意の墓でモノ置換されたアルキル基。ハロアルキル基、 シクロアルキル苺、アルケニル基、アルキニル苺、アル キルスルホニル基、置換基群γより選択される任意の基 でモノ置換されたアルキルスルホニル基、ハロアルキル キノキサリニル基、キナゾリニル基。シンノリニル基又 50 スルホニル基。置換されていてもよいフェニル甚。置換

特闘2002-308857

18 *基、置換されていてもよいフェノキシ甚、アルキルチオ 基。アルキルスルホニル基。アシル基。ハロアルキルカ ルボニル基、アルコキシカルボニル基、シアノ基、カル バモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキ ル基で置換されていてもよい〉が必ず置換する。)、ピ リジン-3-イル基(該基の2位及び4位は、ハロゲン 原子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキ ル蟇、シクロアルキル基、アルコキシ蟇、ハロアルコキ シ基、アルキルチオ基、アルキルスルホニル基、アシル 置換されていてもよい)が必ず置換する。)、ビラゾー 10 基。ハロアルキルカルボニル基、アルコキシカルボニル 基。シアノ基又はカルバモイル基(該基の窒素原子は同 一又は異なってアルキル基で置換されていてもよい〉が 必ず置換する。)、或いはビリミジン-5-イル基(該 基の4位および6位は、ハロゲン原子、アルキル基、ハ ロアルキル基、アルコキシアルキル基、シクロアルキル 基。アルコキシ墓、ハロアルコキシ墓。アルキルチオ 基。アルキルスルホニル基。アシル基。ハロアルキルカ ルボニル基、アルコキシカルボニル基。シアノ基又はカ ルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアル る。)、イソオキサゾール-4-イル基(該基の3位及 20 キル基で遺換されていてもよい)が必ず置換する。) で あるイソオキサゾリン誘導体。

[0038]

【発明の実施の形態】次に、一般式 [I] を有する本発 明化合物の代表的な化合物例を表1~表130に記載す る。しかしながら、本発明化合物はこれらに限定される ものではない。尚、化合物番号は以後の記載において巻 照される。

【0039】本明細書における豪中の次の表記は下記の 通りそれぞれ該当する基を表す。

[0040]

Εt :エチル基. Pェー! : イソプロビル基

Вu :n-ブチル蟇

Buー!:iso-ブチル基 Bu-s :sec-ブチル基

Bu-t:tert-ブチル基 Bu-c :シクロブチル基

Pen :n-ペンチル墓 Pen-c:シクロペンチル基

Hex :n-ヘキシル基 Hex-c:シクロヘキシル基

Ρh :フェニル基

また、例えば(4-C!) Phの表記は4-クロロフェ ニル基、3-Hexは3-ヘキシル基を表す。

されていてもよい芳香族へテロ環基、置換されていても

よいフェニルスルホニル墓、置換されていてもよい芳香

族へテロスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボ

ニル基、置換されていてもよいベンジルカルボニル基、

置換されていてもよいベンゾイル基。アルコキシカルボ

ニル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニ

ル幕、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基又

て、アルキル墓又は置換されていてもよいフェニル基で

ルー5ーイル蟇(ここで該基の4位はハロゲン原子、ア

ルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル基、ハ

基。アルコキシカルボニル基、シアノ基又はカルバモイ

ル基(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で

置換されていてもよい)が、さらに1位は水素原子、ア

ルキル基、置換基群βより選択される任意の基でモノ置

換されたアルキル基、ハロアルキル蟇、シクロアルキル

基又は置換されていてもよいフェニル基が必ず置換す

び5位は、ハロゲン原子。アルキル墓。ハロアルキル

基、アルコキシアルキル蟇、シクロアルキル基、アルコ

キシ苺、ハロアルコキシ苺、アルキルチオ基、アルキル

スルボニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニル基、

アルコキシカルボニル基。シアノ基又はカルバモイル基

(該基の窒素原子は同一又は異なってアルキル基で置換

されていてもよい)が必ず置換する。)、イソチアゾー

子、アルキル基、ハロアルキル基、アルコキシアルキル

基。シクロアルキル基、アルコキシ蕃。ハロアルコキシ*30:

:メタル基

Prーc:シクロプロビル基

:n-プロピル蟇

ルー4-イル基(該基の3位及び5位は、ハロゲン原

Мe

Ρr

ロアルコキシ基、アシル基、ハロアルキルカルボニル

はカルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なっ

【①041】尚、本発明化合物は置換基として水酸基を 含む場合、ケトーエノール互変異性体を有する化合物が

あるが、何れの異性体もその混合物も本発明化合物に含 40 まれる。

[0042]

【表1】

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

2/16/2005

特闘2002-308857

							(11	.)		特闘2002			
		19								20			
	R1 R2 R3 R4 R2Z R23 R24												
\mathbb{R}^1	R ²	R3	R4	R	Rª	R ⁸	\mathbf{Z}^{1}	R ²²	R ²⁸	R ²⁴			
Me	Me	Н	H	2	H	H	\$	Me	Н	H			
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	S	Cl	Me	H			
Me	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Me			
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CI	H	H			
ivie	Me	H	H	2	H	H	S	H	H	Cl			
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	8	CI	CI	Cl			
Me	Me	H	H	2	H	H	\$	OMe	H	H			
Me	Me	H	H	2	H	H	S	OEt	H	H			
Me Me	Me Me	H	H H	2 2	H	H	S	OCHF.	H	H			
		H			H	H	S	OCH ₂ Ph	H	H			
Me	Me	H	H	2	H	H	0	H	H	H			
Me	Me	H	H	2	H	H	0	H	H	C(=O)OMe			
Me Me	Me Me	H	H	2 2	H	H	NMe NMe		H C(=0)OMe	Me CH ₂ C(=O)OMe			
Me	Me	H	H	2	и	H	NMe		C(=O)OEt	CH ₂ C(=0)OEt			
Me	Me	н	н	2	H	н	NMe		Me	Me			
Me	Me	H	H	2	H	Н	NPh	OMe	H	H			
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OEt	H	H			
Me	Me	Ĥ	Ĥ	2	H	Ĥ	NPh	OCHF ₁	H	H			
H	H	H	H	2	H	H	S	OCHF.	H	H			
Me	н	Н	н	2	н	H	S	OCHF.	H	H			
Me	H	Me	H	2	H	И	S	OCHF.	H	н			
Me	Me	H	H	2	Me	H	S	OCHF.	H	н			
Me	Me	н	H	2	Et	Ħ	S	OCHP ₂	H	H			
Me	Me	H	Н	2	Pr∙i	H	S	OCHF:	H	Н			
Мe	Me	н	Н	2	Me	Me	8	OCHF,	H	Н			
Me	Eε	н	H	2	H	Ħ	S	OCHF,	H	H			
Et	Et	H	H	2	H	H	S	OCHF ₂	H	H			
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	8	OCHF ₂	н	н			
Me	Pr	H	H	2	H	H	8	OCHF ₂	н	н			
Me	Pr-e	H	H	2	H	H	8	OCHF,	H	H			
Мe	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	8	OCHF,	H	н			
	CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	8	CI C	CI	a ~			
•	(CH ₂) ₃ .	H	H	2	H	H	\$	a	Cl	a			
-1	(CH ₂) ₅ . (CH ₂) ₅ .	H	H	2	H	H	8	CI CI	C1	CI CI			
H	-(CH ₂)		H	2 2	H H	H	S	CI CI	C1 C1	a a			
H	-(CH ₂		н	2	H	H	S	C1	CI	a			
H	-(CH ₂	/4" \	H	2	Ħ	H	8	Ci.	CI	a			
Н	-(CH ₂)		H	2	ਜ	H	S	Ci	Ci	a			

[0043]

【表2】

. 450 1 01 1

(12)

特闘2002-308857

	-
	•

RI	R ³	R³	R ⁴	n	R	Re	2,1	R22	R ²⁸	R ²⁴
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	H	н
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	Me	Н
Me	Me	H	H	1	H	н	\$	H	H	Me .
Me	Me	H	Н	1	H	н	8	CI	H	H
Me	Me	H	H	1	H	н	\$	Ħ	H	Cl
Me	Me	H	H	1	H	н	S	Cl	C1	C1
Me	Me	H	Н	1	H	н	S	OM ₀	H	H
Me	Me	н	H	1	H	н	S	OEt	H	H
Me	Me	H	H	1	Н	H	S	OCHE,	н	H
Me	Me	Н	H	1	H	H	S	OCH ₂ Ph	H	H.
Me	Me	H	H	1	H	H	0	H	H .	н
Ma	Me	H	H	1	H	Н	0	Н	H	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	1	E	H	NMe	Me	H	Me
Me	Me 'Me	H	H	1	H	H	NMe		C(=0)OMe	CH ₂ C(=O)OMe
				1		H	MMe	ì	C(=0)0Et	CH ₂ C(=O)OEt
Me	Me	H	Н	1	H	H		Me	Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OMe	H	<u>H</u>
Ma	Me Me	H	H	1	H	H	NPh NPh	OEt OCHF,	H H	H H
H	H	Н	H	1	H	H	S		H	H
Me		H	H	1	H	H	8	OCHF ₂	н	H.
Me	Ħ	Me	н	î	H	H	S		H	H
Me	Me	H	н	1	Mo	н	Š	OCHP.	H	H
eM	Me	н	H	1	Et	н	8	OCHE.	H .	H
Me	Me	H	н	1:	Pr-i	Ħ	S		н	H
Me	Me	н	H	1	Me	Me	S	OCHF,	H	Н
Me	Bt	H	Ħ	1	H	Ħ	8			н
Et	Bt	Ι·Ι	H	1	H	H	8	OCHF.	H	H
Me	Pr-i	H	H	1	Ħ	H	\$	OCHF ₂		Н
Me	₽ <u>r</u>	Ħ	H	1	Ħ	Ħ	S	OCHF.		H
Me	Pr-c	н	H	1	H	H	S	OCHP ₂	H	H
Me		н	H	1	H	H	S	OCHF2	H	H
3	CHJ.	H	H	1	H	И	S	Cl	α	CI
	(CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	S	CI	C)	Cl
	(CH2)4-	H	Ħ	1	H	H	\$	CI.	CI	CI
	(CH ₂) ₃ .	H	H	1	H	H	8	C1	CI	CI
H	·(CH ₂)		H	1	H	H	8	Cl	CI	Cl
H	·(CH ₂)	4-	H	1	H	H	S	C1	ຒ	Cl
H	·(CH ₂)		HH	1	H	H	8	C1	C)	CI
1 1	-(CH ₂)		1	1		H	8	Cl	CI	CI
Me	Me	H	H	0	H	II.	8	Me		H
Me	Me	H	H	0	H	H	8	Cl		H
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	.g	H		Me
Me	Me	H	H	0	H	H	8	CI	H	ij
N1G	DVIG	11	н	0	н	H	S	H	н	Cl

[0044]

【表3】

(13)

23

特闘2002-308857

24

\mathbb{R}^1	\mathbb{R}^2	R8	R4	n	R ⁵	R [€]	Zì	R*2	R ²⁰	R ²⁴
Me	Me	Н	H	O	H	H	\$	Cl	C1	Cl
Me	Me	H	H	Ð	H	H	S	OMe	н	H
Me	Me	H	н	Ð	н	H	S	OEt	H	H H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	Ħ	
Me	Me	H	H	0	H	H	S	OCH ₂ Fh	H	H
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	0	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	0	H	H	C(=0)OMe
Me	Me	H	H	0	Н	H	NMe		H	Me
Me	Me	H	Ħ	0	Н	H	NMe			CH ₂ C(=0)OMe
Me	Me	H	H	0	Н	H	NMe		C(=0)OEt .	CH ₂ C(=0)OEt
Me	Me	H	H	0	H	H	NMe		Me	Me
Me	Мө	H	Н	0	H	H		OMe	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh		H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh		H	H
H	H	н	H	0	H	H	S	OCHF2	H	н
Me	H	H	H	0	H	H	S	OCHF2	H	H
Me	H	Me	H	0	H	н	S	OCHF ₂	R	H
Me	Me	H	H	0	Me	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Me	H	H	0	Et	H	· S	OCHF2	H	H
Me	Me	H	H	0	Proi	H	8	OCHF ₂	H	H
Me	Mo	H	H	Û	Me	Me	S	OCHF _z	H	A
Me	E4	H	H	0	H	Н	S		H	H
Et	Et	H	H	0	H	Н	S	OCHF.	H	H
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	8	OCHF;	H	H
Me	Pr	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Me	Pr-c	H	H	0	H	H	S	OCHF ₂	H	H
Mo	CH ₂ Pr-c	H	H	Û	H	H	S	ochf,	н	H
	CH ₂) ₂ -	H	H	9	Ħ	H	S	Cl	Cl	CI
	(CH ₂) ₃ -	H	H	9	Н	H	S	a	Cl	CI.
- (CH ₂) ₄ ·	H	H	0	H	H	\$	a	CI	a
-1	CH ₂) ₅ .	H	H	0	Н	H	\$	CI	CI	a
Ħ	·(CH _e))a-	H	0	H	H	8	Cī	CI	CA
H	-(CH ₂)	4-	H	0	н	H	S	CI	Cı	CI
H	-(CH ₂)	5-	H	0	H	H	\$	a	CI	a
H	H (CH ₂) _e -		H.	0	H	H	S	Cl	Cl	CI
Me	Et	H	H	2	H	H	S	H	Н	H
Me	Et	H	H	2	Н	H	0	H	Н	H
Me	Et	H	Н	2	H	H	NH	H	H	H

[0045]

【表4】

特闘2002-308857

		;	25						•		26
Γ				2² I	R P	4			_		
			R1-	<u>, Ż</u>	Ź,,		_	R ²	⁶ ,R ²⁷		
ĺ				Ó.	人		R	`	=(
l				1	1	`S(C)) - C		⊱ -ݲ		
l							R	• 1	25		
L											
L	R,	R ²	R3	Rª	n	R ⁵	R ⁶	Z2	R ²⁵	R ²⁵	R27
	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Ħ	H	H
	Me	Me Me	H	H	2 2	H	H H	S S	H	OM _e	E CI
ŀ	Me Me	Me	H	H	2	H	H	ŝ	CI CI	H Cl	CI
l	Mo	Me	H	H	2	H	H	s	la	Ma	B CT
ı	Me	Me	H	H	2	H	H		NHMe	Me	ä
l	Me	Me	ਜ	н	2	H	瓦	S	N(Me) ₂	Me	Ħ
ı	Me	Me	H	H	2	H	H		NHC(=0)Me	į	н
ı	Me	Me	H	Ħ	2	H	H	Š	NHC(=0)Ph	Me	Ħ
١	Me	Me	H	H	2	H	H		NHSO ₂ Me	Me	H
ı	Me	Me	H	Н	2	H	H	s	NHSO ₂ Ph	Me	H
ļ	Me	Me	Н	Н	2	H	H				Me
ı	Me	Me Me	Н	н	2	H	Н	S S	Me Me	Me C(=0)OMe	Mo
ı	Me	Me	H	Ĥ	2	Ħ	H	S	Me	C(=O)OEt.	Me
ľ	Me	Me	H	н	2	H	H	š	Me	C(=0)OPh	Me
ı	Me	Me	H	H	2	Ħ	H	Š	Me	CN	Me
١	Me	Me	H	H	2	H	H	8	Me	C(=0)NHMe	Me
ı	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Me	Me
l	Ме	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=O)Et	Me
l	Me	Me	H	H	2	H		S	Me	C(=O)Pr·i	Me
	Me	Me	H	H	2	H	Н	S	Me	C(=0)Pr	Me
ŀ	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	C(=0)CF,	Me
	Me	Me	H	H	2	H	H	8	Me	C(=NOMe)Me	Ме
ı	Me Me	Me Me	H	H	2 2	H H	H	8	Ph Ph	C(≃O)Me C(=NOMe)Me	Me Me
١	Me	Me	н	Н	2	Н	H	s		OMe	H
ŀ					_				CF ₃		
1	Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	OBt	H
1	Me	Me	H	H	2	H	H	8	CF ₈	OPr-i	H
1	Me	Me	H	Ħ	2	H	H	ន	CF ₉	OPr-i	H
1	Me	Me	H	Н	2	H	H	S	CF _s	OCHF2	H
I	Me	Me	H	H	2	H	H	8	Cl	Ме	H
1	Me	Me	H	н	2	H	H	8	Cl	Me	Me
i	Me	Me	Ħ	H	2	H	H	S	CI	C(=0)OMe	C1
1	Me	Me	H	H	2	H	H		CI	CN	C1
	Me	Me M-	H	H	2	H	H	S	C1	C(=0)NHMe	CI CI
1	Me	Me	H	Ħ	2	H	H	8	Cl	C(=O)N(Me) ₂	CI.
1	Me	Me Me	H	H	2 2	H	H	s s	Cl	C(=0)Me	CI.
	Me Me	Me	ᇤ	H	2	H	Н	S	CI CI	C(=0)Et C(=0)Pr-i	C) C1
l	Me	Me	H	Ħ	2	H	H	š	ci	C(=0)Pr	a
1	Me	Me	н	H	2	H	н	s	Či.	C(=O)CP ₈	ci
۱	Me	Me	H	H	2	H	Ħ	s	a	C(=NOMe)Me	lci
•									*	. —	

[0046]

【表5】

(15)

27

特闘2002-308857

4	o	

\mathbb{R}^1	\mathbb{R}^2	Rª	R	n	n^{5}	R	22	R ²⁶	R ²⁰	R ⁸⁷
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	Ö	H	H	H
Me	Me	H	H	2	H	H	O	Me	H	CI
H	H	H	H	2	H	H	S	C!	C1	C1 C1
Me	X	H	H	2	H	H	S	CI	CI.	CI
Me	H	Me		2	H	H	ន្ធន	CI	CI	(C)
Me	Me	H	H	2	Me	H	ន្ត	Ci	CI	CI
Me Me	Me Me	H	Ħ	2 2	Bt	H H Me	2	CI CI	(1) (2)	CI ,
Me	Me	[4]	H	2	Pr- Me	112 240	9	a	G	ପ
Me	Et	H	н	2	H	H	S	lä	ä	Sa
Et	Et	н	н	2	H	F	š	à	Či.	C
Me	Pri	H	Н	2	H	Ħ	S	lã	ci	Ċi .
Me	Pr	н	Н	2	H		S	Ci	CI	Ċi i
Me	Pr-c	H	Н	2	Н	H	S	C1	Cı	CI
Me	CH ₂ Pr-c	A	H	2	H		S	CI	CI	CI .
-((H ₂)3-	H	н	2	н		s	CI CI	CI.	CI CI
	H ₂) ₃ .	B	ΙŦ	2	И	•	8	C1	ca	CI
	CH ₂) _q .	H	н	2	н	н	S	CI.	CI.	CI
	H ₂) ₅ .	Ħ	H	2	Ħ	Ħ	s	C1	CI CI	a
H	-(CH _z		Ħ	2	H	Ħ	S	Cl	CI.	ca
H	-(CH ₂		Ħ	2	Ħ	H	ន	CI	CI.	CI
н	-(CH ₂		H	2	H	H	ន	a	a	(CI
H	-(CH ₂	6	H	2	н	H	ន	Cl	cı	CI.
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	S	H	H	ਬ
Me	Me	H	H	1	Ħ	Ħ	8	H	OMo	H I
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	S	CI	H	[CI `
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Cl	CI	CI
Me	Me	H	H	1	프	H	න න න න	Cl	Me	Ħ
Me	Me	H	H	1	日			NHMe	Me	Ħ
Me	Me	H	H	1	H	H	S	N(Me) ₂	Me	Ħ
Me	Me	H	H	1	H	H		NHC(=0)Me	Me	H
Me Me	Me Me	H	H	1	H	H		NHC(=0)Ph	Me	H H
Me	Me	л Н	н	1	田田		ន	NHSO ₂ Me NHSO ₂ Ph	Me	fi.
Me	Me	H	н	1	H			Me JUJUN	Me	
Me	Me Me	H	H	1	H	TI	72 0	Me Me	Me C/-O)CN-	Mo
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	2	Me Me	C(=O)OMe C(=O)OEx	Me Me
Ma	Me	H	H	ī	H	H	3	Me	C(=O)OPh	Me
Me	Me	H	H	î	e	H	ទ	Me	CN	Me
Me	Me	H	H	i	H	H	Š	Me	C(=O)NHMe	Me
Me	Me	H	H.	t	H	H	S	Me	C(=0)Me	Me
Me	Me	H	H	ı	H	H	ន	Me	C(=O)Et	Me
Me	Me	H	H	ì	H	H	ល ល ល ល ល ល ល ល ល ល	Me	C(=O)Pr·i	Me
Mo	Me	H	H	ı	H	H	S	Me	C(=O)Pr	Me
Me	Me	H	H	Ł	H		ន	Me	C(=O)CF _a	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	S	Me	C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	Ħ	Ħ	1	H	H	S	Ph	C(=0)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	s	Ph	C(=NOMe)Me	Me

[0047]

【表6】

(16)

29

特闘2002-308857

Rt	R ³	R.ª	\mathbb{R}^4	n	R	R5	Z²	R ²⁸	R ²⁶	R ²⁷
Me	Me	H	Ħ	1	Ħ	H	S	CF ₃	OMe	H
Me	Me	н	н	1	н	Н		CF ₃	OBŧ	H
Me	Me	B	Н	1	н	Н		CF.	OPr-i	Ħ
Me	Me	H	a	1	н	H		CF ₃	OPr-i	Ħ
Me	Me	H	Н	1	11		S	CF.	OCHF.	Ħ
Me	Me	H	H	ı	H			Cl Cl	Me	H G
Me	Me	H	H	ī	Ħ	H	ន្ធន	ä	Me	Me
Me	Me	Ħ	Ħ	1	H	H	Š	lCi.	C(=0)OMe	lcı
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	S	lC1	CN	Cl
Me	Me	H	a	1	H	H	S	CI	C(=0)NHMe	CI
Me	Me	H	Ħ	1	H		S	Cl	C(=0)N(Me) ₂	Ci
Me	Me	H	H	1	H	H	ខ្លួន	a	C(=0)Ma	a
Mo	Me	H	H	1	H	H	9	CI CI	C(=0)Et	CI
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	S	Cl	C(=0)Pr-i	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	S	a	C(=0)Pr	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	s	a	C(=0)CF ₃	Ct
Me	Me	H	H	1	H	H	မ ()	CI	C(=NOMe)Me	<u>C</u> I
Me	Me	H	H	1	H	H	ŏ	H	H	A
Me	Me	H	H	1	됐		0	Me .	H CI	CI CI
H Mo	H	H	H	I 1	H	H	20	CI CI	ä	CI.
Me	H	Me	H	1	H	Ħ	S S	ପ ପ	či	či
Me	Me	H	II.	i	Me	H	ŝ	ă	či	či
Me	Me	ŀ	H	i	Ľt	Ĥ	S	ä	ä	Či
Me	Me	H	H		Pr	H	<i>ភាព</i> ភាព ភាព ភាព ភាព ភាព	ପ ପ	ය ය	ici i
Me	Me	H	H	1	Me	Me	8	a a	IC1	C)
Me	Et	H	H	1	H	H	ន	a	cı	CI
Et	Et	표	H	1	H	Ħ	S	CI	CI CI	CI
Me	Pr-i	H	H	1	H	Ħ	23	CI CI	C1 C1	CI CI
Me Me	Pr Pr-≎	日日	H	1	H	H	20	a a	CI	CI CI
	CH ₂ Pr-c		H	1	H	H	S	CI	CI	CI CI
		H	H	1	H		S	CI.	CI	CI
	H ₂) ₂ .))			1 1					1
(H ₂) ₃ .	H	H	1	H		Ş	CI.	CI	CI
	H2)5	H	Ħ	1	H		ន	a	Cı	CI
	H ₂) ₅ .	H	H	1	H		S	a	CI	CI
H	-(CH ₂		Ħ	1	H	H		CI.	CI	CI
11	-(CH ₂)4"	Ħ	1	H	н	s	a	cı	C)
H	-(CH;)5-	н	1	H		S	a.	CI	CI
H	(CH ₂)6-	ĸ	1	H	H		CI.	CI	CI
Me	Me	H	H	0	H.	Ħ	S	H	H	н
Me	Me	H	H	0	Ħ	Ħ	9	H	OMe	H
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CI.	H	ကြ
Me	Me	H	H	0	H	H	5	CI.	Cl	CI H
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	s	CI NI-IMe	Me Me	H
Me	Me	H	Н	ő	H	H	o o	N(Me) ₂	Me	H
nae	1916	1 11	14		F1.	1.7	<u> </u>	Traches 15	hua	l _{tz}

[0048]

【表7】

(17)

特闘2002-308857

	3 <u>1</u>							\- /		32
			_							
RI	Ľ3	R _g	R	n	\mathbb{R}^5	R¢	Z2	R ²⁵	R ²³	Rat
Me	Me	И	H	0	H	H	Š	NHC(=O)Me	Me	Н
Me	Me	H	H	0	H	H	8	NHC(=O)Ph	Me	H
Me	Me	Н	H	0	H		S	NHSO ₂ Me	Me	H
Me	Me	H	Н	0	Ħ	H	S	инзо _з рь	Me	H
Me	Me	н	H	0	H	Н	8	Me	Me	Me
Mo	Me	H	Н	0	H	Н	s	Me	C(=O)OMe	Me
Me	Me	Н	H	0	H	Н	S	Me	C(=O)OEt	Me
Me	Me	н	H	0	H	H	S	Ma	C(=0)OPh	Me
Mo	Me	H	H	0	H	Н	ŝ	Me	CN	Me
Me	Me	Я	H	0	H	H	S	Me	C(=0)NHMe	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	8 3	Me	C(=0)Me	Me
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	S	Me Me	C(=O)Et	Me Me
Me	Me	н	띪	0	H	н	S	Me	C(=0)Pr-i C(=0)Pr	Me
Me	Me	H	H	0	H		3	Me		Me
			H						C(=0)CF ₂	
Me Me	Me Me	H		0	H		60 0	Me	C(=NOMe)Me	Me Me
Me	Me	Н	H	0	H	H	S	Pb Pb	C(=0)Me C(=NOMe)Me	Me
Me	Me	H	Н	0	H		8	CF ₅	OMe	H
Me	Me	H	Н	0	H	H	\$	CF ₂	OEt	H
Me	Me	H	H H	0	H	H	S	CF ₅	OPr-i	H
		H					S			4
Me	Me		뇄	0	H	H		CF ₈	OPr-i	H
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	s s	CF,	OCHF, Me	H
Me	Me	H	H	0	H	H	3 3	a	Me	Me
Me	Me	H	日	Ö	Ħ	H	S	Ci Ci	C(=9)0Me	CI
Ma	Me	ä	H	ŏ	H	H	S	ä	CN	lä
Me	Me	н	H	0	H	H	S	CI CI	C(=0)NHMe	Ci
Me	Me	13	빔	0	H		S	Ci.	C(=0)N(Me)2	ci
Me	Me	Ħ	н	û	Ħ	H	S	CI CI	C(=0)Me	la l
Me	Me	н	Н	ō	н	H	S	Ċì	C(=O)E¢	ci
Mo	Me	И	Н	0	H	H	8	CI	C(=O)Pr-i	CI
Me	Me	H	Н	0	H	H	S	CI	C(=O)Pr	C1
Me	Me	H	H	0	Н	H	ន	C1	C(=O)CF ₃	CI
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	S	C1	C(=NOMe)Me	C1
Me	Me	H	H	ø	Н	H	0	H	H	H
Me	Me	H	H	0	H	H	0	Me	H	CI.
H	Ħ	H	H	0	H	H	s	CI O	CI	CI CI
Me	H	H	H	0	H	H	S	C1	C1	CI
Me Me	H Me	Me H	H	0	H Me	H	S S	C1 C1	C1 C1	(a) (a)
Ma	Me	H	H	٥	Ei	H	8	Ci	lci	Ci
Me	Me	н	H	0	Pr-		ls	ä	la la	C
Me	Me	H	H	õ		Me	S S	ci	či	a
Me	Et	H	H	ō	H	H	8	ci	Cl	CI
Et	Et.	H	H	0	H	H	B	Cl	CI	C1
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	S	Cl	C1	CI
Me	_Pr	H	H	0	H		S	Cl	CI	CI
Me	Pr-c	H	Ħ	0	H	H	ន	Cl	JC1	CI

[0049]

【表8】

(18)

特闘2002-308857

		"								34
R1	R ²	R ⁸	R4	n	\mathbb{R}^{5}	Re	Z^{ϵ}	R ²⁵	R ²⁶	R ²⁷
Me	CH ₂ Pr-c	B	H	0	H	H	8	Cl	Cl	Cl
•	(CH ₂) ₂ -	H	H	Ð	H	H	S	a	Cl	Cl
-	(CH ₂) ₈ -	Ħ	H	0	H	H	s	cı	Cl	Cı
	(CH ₂) ₄ -	H	н	0	H	н	s	CI	Cl	C1
-	(CH ₂) ₅ -	H	н	0	Н	H	s	cı	Cl	C1
H	·(CH ₂)3-	H	0	Н	н	s	a	CI	Cl
H	-{CH ₂		H	0	H	Ħ	S	CI	Cl	C1
H	-(CH ₂)5-	H	0	H	ы	В	Cı	Cı	Cl
H	-(CH ₂		H	Q	H	H	S	CI	CI	Ci.

[0050] [数9]



(19)

特闘2002-308857

								\ /	• • • • • • •				
			35						36				
	R ¹ R ² R ⁵ R ⁶ R ²⁹ N R ²⁸												
Ri	R ²	R3	R*	n	₽ ⁵	Rô	R ²⁰	\mathbb{R}^{28}	R30				
_	Mo	н	H	2	Ħ	Ħ	CI	н	a				
Me	Me	H	Ħ	2	ΙŦ	H	OCHF2	H	CI				
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	OCHF2	H	OCHF2				
Ne	Me	н	н	2	н	H	Me	H	C1				
Me	Me	14	H	2	И	H	Ma	H	OCHF ₂				
Me	Me	14	ĸ	Ž	H	Ħ	CHF2	31	C1				
Me	Me	G	Н	ż	H	н	СНЕ	а	OCHF.				
Ma	Me	Ħ	н	2	ĸ	н	CF,	H	F				
Me	Ме	H	н	2	н	H	CF ₃	H	C3				
Me	Me	н	н	2	Н	H	CF ₃	A	OMe				
Me	Me	Н	H	2	Н	Н	CF,	स	ORt				
Ma	Me	Н	H	2	Н	Н	CF ₃	H	OCHF:				
Ma	Me	Н	н	2	H	H	CF ₂	H	CN				
Ме	Me	н	н	2	Н	H	CF ₂	H	Ме				
Me	Me	н	н	2	H	Э	н	Me	cı				
Me	Me	н	н	2	Н	H	Me	Ме	Me				
Me	Me	H	н	2	H	н	Me	Me	F				
Me	Me	н	н	2	н	Ħ	P	Ме	Me				
Me	Me	ы	Н	2	H	Н	Me	Me	CI				
Me	Me	Н	Ð	2	H	Ĥ	C)	Me	Me				
Мe	Me	Н	Ħ	2	H	Ħ	Me	Me	OMe				
Me	Me	н	H	2	Н	H	OMe	Me	Me				
Me	Me	н	н	\$	H	a	Me	Me	OCHP ₂				
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	ochr,	Me	Me				
Me	Me	H	H	2	Н	A	Me	Me	CN				
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	CN	Ме	Me				
	Me	A	H	2	Н	н	E:	Me	P				
Ma	Ma	H	н	2	H	н	F	Ме	E1				
Me	lide-	H	Ħ	ន	н	Н	Et	Me	cı				
Me	Me	н	H	2	Ħ	Я	CI	Ne	Et.				
Me	Me	Н	H	ż	н	н	Et	₽J e	OMe				
1	Me	Н	H	2	H	н	OMe .	Me	Et				
	Me	н	H	3	н	н	Ke	B1e	OCHF:				
Me	Me	H	Н	2	н	Ιн	OCHP,	Me	ICt .				

[0051]

【表10】

(20)

特闘2002-308857

			37			_			38
R^1	R²	R ³	R*	Ľ	R	Ř	R ²⁹	R ²³	R ⁸⁵
Me	Me	H	Ħ	2	H	Ħ	CN	Me	Bŧ
Me	Me	H	н	2	H	н	Pr-i	Mie	P
Me	Me	н	н	2	H	Н	F	Me	Pr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	Pri	Me	CI CI
Me	Me	н	H	2	H	H	Cl	Me	Pr-i
Me	Me	н	H	2	H	Ħ	Py-i	Me	OMe
Ме	Me	н	ㅂ	2	H	Ħ	OMe	Me	Pr-i
4∙ie	Мe	H	Ð	2	H	ਸ਼	Pr-i	Me	OCHP2
Me	Me	Ħ	Ħ	2	H	H	OCHF ₂	Me	Pr-i
l∿§e	Me	Ħ	н	2	H	Ħ	Pe-i	Me	CN ·
Мe	Me	H	H	2	H	н	CN	Me	Pr-i
214	Me	H	ห	2	H	н	Bu-t	Me	P
Me	Me	H	н	z	н	ы	F	Me	Bv-t
Мв	Me	н	H	2	Н	н	Bu∙t	Me	cı
Me	Me	н	Н	2	н	H	a	Me	Bu-t
Me	Me	н	H	2	Н	н	Bu·t	Me	OMe
Me	Me	н	н	2	н	Ы	OMe	Ma	Bu-t
Me	Me	H	H	2	H	Н	Bu-t	810	осне,
Me	Ме	н	н	2	H	Н	OCHF ₂	Me	But
Ma	Me	н	н	2	H	н	Bu-t	Me	CN
Me	Me	н	н	2	Ħ	н	CN	Me	Bu-t
Me	Me	н	н	2	Ħ	н	CH ₂ OMe	Mie	P
Mo	Me	н	н	2	Ħ	н	F	Me	CH _z OM _e
Me	Me	н	F)	2	H	н	CH ₂ OM2	Me	CI
Me	Me	ы	ы	Ż	H	н	Ci	Me	CH _s OMe
Me	Me	н	Ħ	2	H	H	СН2ОМо	Me	OMe
Me	Me	н	R	2	н	H	OM=	Me	CH ₂ OMe
λie	Me	H	н	2	н	н	CH ₂ OMe	Me	OCHF ₂
Me	Me.	H	Ħ	ż	H	н	OCHF2	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	е	H	2	Н	H	CH ₂ OMe	Me	CN
λĵę	Me	H	н	2	H	લ	CN	Me	CH ₂ OMo
Ме	Me	H	H	2	н	н	C!	Me	Cl
λje	Ме	H	H	2	H	н	CHF,	Me	Cl
Ме	Me	н	н	2	H	н	Cl	Me	CHP4
Me	Me	H	Н	2	Ħ	Ħ	OCHF,	Me	H
Ме	Me	н	н	2	A	н	OCHF2	Me	F
Me	Me	H	н	2	H	н	F	Me	ochf,
Me	Me	H	H	2	Ħ	н	OCHT:	Me	Cl
Me.	Me	H	Ħ	2	Ħ	н	Ci	Me	ochf,
Me	Me	Ħ	H	2	H	н	оснр,	Me	OMe

[0052]

【表11】

(21)

特闘2002-308857

		_	

Ri	R ²	R ⁵	R1	n	R⁵	Re	Rº	R ²⁸	R ^{w3}
	Me	Н	H	2	Ħ	H	OMe	Me	OCHF ₂
Me	Me	н	н	2	H	H	OCHIF2	Μθ	OCHF2
Me	Me	H	Н	2	Н	Н	OCHF2	Ma	CN
Me	Me	H	H	2	ľi	Н	CN	Ma	OCHF ₂
Me	Me	Я	H	2	Ħ	Ħ	CF,	Me	н
Me	Me	Ħ	ਜ	2	H	н	CF,	Me	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	C1	Me	CF ₃
Мe	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	Br
Me	Me	幵	Ħ	2	H	H	Br	Me .	CF,
Ma	Me	Ħ	H	2	н	н	CF,	Mo	I .
Ma	Me	H	Ħ	2	H	н	ī	Me	CF ₃
Me	Me	Н	н	2	н	н	CF ₂	Me	P
Me	Me	H	н	2	н	н	P	Me	CF,
Me	Me	H	ㅂ	2	H	Ħ	CF ₁	Me	он
Me	Me	H	H	2	H	H	OH	Me	CP,
Me	Mo	H	н	2	H	н	CF ₃	Me	OMe OMe
Me	Me	н	H	2	Ħ	Ħ	OMe	Me	CF,
Me	Me	PI	EJ	2	Ħ	Ħ	CF₃	Me	oel
Μe	Me	Ħ	H	2	Ħ	В	OEt	Me	CF₄
Me	Me	Ħ	Ħ	2	Ħ	Ħ	CF ₃	Ma	OPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	CF,	Me	OPr
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	Me	OBu-t
Mie	Me	H	H	3	н	Н	CF,	Ma	OBu-s
Mie	Me	Ħ	H	2	H	H	CF,	Me	OBu-i
N/10	Me	B	H	2	н	Ħ	CF,	Me	OBa
Me	Me	丑	H	2	H	H	८४.	Me	O(2-Pen)
	Me	H	Ħ	2	H	Н	CF;	Me	O(S-Fen)
	Me	B	Ħ	2		H	CP ₃	Me	OPen-n
	Me	H	H	2	H	H	CP,	Me	O(2-Hex)
ı	Me	H	H	2	Ж	H	CF3	Me	O(3-Hex)
	Me	H	H	2	H	H	CF3	Me	OHex-n
	Me	н	H	Ł	H	H	CF3	Me	OPen-c
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ma	OHex-c
1	Me	H	Н	2	H	H	CF ₂	Me	OCH ₂ Pr-c
	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	OCH ₂ Bu-o
	Me	H	H	પ્ટ	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pex-c
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OCH Hes-o
	Me	Н	H	2	H	Ħ	CF ₃	Me	OCH-CH=CH2
1	Me	H	Ħ	Z		H	CF3	Me	OCH3C≡CH
Me	Мe	Ħ	H	2	H	H	CF _s	Me	oche,

[0053]

【表12】

(22)

41

特闘2002-308857

42

R1 R2	R3	R4	n	\mathbb{R}^5	Rª	R ²⁹	R ²¹	R ⁸⁰
Me Me	Ħ	н	2	Ħ	H	OCHFt	Mo	CP ₃
Me Me	н	H,	2	n	н	CF,	Me	och ₂ chf,
Me Me	H	H	2	Ħ	H	OCH,CHF,	Me	CF,
Me Me	н	Н,	2	H	Ħ	CF,	Me	OCH ₂ CF ₃
Me Me	H	A	2	A	H	OCH ₂ CF ₂	Me	CF ₄
Me Me	H	Ħ	2	Н	Ħ	CF,	Me	och₂cn
bie bie	H	H	2	H	H	CF,	Me	OCH2C(=O)OE2
Me Me	Ħ	H	2	H	H	CF,	Me	OCH(Me)C(=O)OE&
Me Me	H	H	2	н	н	CF,	Ma	OCH ₂ C(=O)NH ₂
Me Me	H	Ħ	2	н	H	CF,	Ma	OCH ₂ C(=0)NHMe
Me Me	H	н	2	H	н	CP,	Ma	OCFl ₂ O(=O)N(Me) ₃
Me Me	н	H	2	H	H	CF,	Me	OCH ₂ Ph
Me Me	ĸ	H	2	H	Н	CF ₃	Me	OPb ·
Mc Me	H	Н	2	H	Ħ	CF ₁	Ме	O(2-Cl)Ph
Me Me	н	H	2	H	Н	CF ₃	Me	O(2-Br)Ph
Me Me	H	H	2	н	Н	CF,	Me	O(2-F)Pb
Me Me	н	н	2	H	н	CF ₈	Me	O(2-Me)Ph
Me Me	H	H	2	H	H	CF.	Mo	O(2-OMe)Ph
Me Me	Ħ	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-NO ₂)Ph
Mc Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-CN)Ph
Me Me	H	H	2	H	И	CF,	ble	0(2-C(=0)OMe)Ph
Me Me	H	H	ષ્ટ	Ħ	Н	CP ₃	Ma	O(3-C!)Ph
Me Me	14	H	2	И	H	CP,	Mio	O(8-Be)Ph
Mc Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₂	Ma ·	O(3-F)Pb
Me Me	н	н	2	Ħ	H	CF.	Me	O(3-Me)Ph
Me Me	H	Ħ	2	H	Ħ	CF,	lie	O(3-OMe)Ph
Me Me	H	H	2	H	E	CF,	Me	O(3-NO ₂)Pb
Me Me	H	끍	2	H	Ħ	CF,	Me	O(3-CN)Ph
Me Me	Н	H	2	Ħ	H	CF3	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph
Me Me	H	H	2	H	н	CF ₁	Me	O(4-CI)Ph
Me Me	н	H	2	H	H	CF,	Mo	O(4-Br)Pb
Me Me	H	H	2	H	A	CF ₀	Me	O(4-F)Ph
Me Me	H	H	2	H	H	CF,	Me	O(4-Me)Ph
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₂	Me	O(4-OMo)Ph
Me Me	A	H	2	H	н	CF3	Me:	O(4-NO ₂)Ph
Me Me	H	H	2	H	H	CP ₈	Me	O(4-CN)Fb
Me Me	H	K	2	Н	Н	CL*	Me	0(4-C(=0)OMa)Ph
Me Me	H	Н	2	Н	н	CF ₈	Me	OC(=O)Me
MalMe	н	H	2	H	Н	CF ₂	Me	OC(=0)Et
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OC(=0)CH ₂ Ph

[0054]

【表13】

(23)

43

特開2002-308857

А	A	

R ^t R ²	R ³	Ri	n	R ⁶	R	R ²³	R ²⁶	R ⁵⁰
Me Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₃	Me	OC(=O)CF ₅
Me Me	H	ਜ਼	2	Ħ	Ħ	CF ₃	Me	OC(=0)Ph
Me Me	ਸ	H	2	Ħ	H	CF ₃	Me	OSO ₂ Me
Me Me	H	Ħ	2	K	Ħ	CF ₃	Me	OSO ₂ Et
Me Me	H	H	2	H	Ħ	CF,	Me	OSO₂Cfl₃Ph
Ме Ме	Ħ	ਜ	2	Ħ	н	CF,	Me	OSO ₂ CF ₃
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₅	Me	080 ₂ Ph
Me Mo	H	H	2	Н	H	CF ₈	Me	SMa
Me Me	H	Н	2	H	Ħ	CF,	Me	SOMe
Ма Ма	H	н	2	H	н	CF,	Me	SO _z Mo
Mc Me	H	H	2	H	H	CF,	Me	SEt
Me Me	Н	Н	2	H	н	CF ₂	Me	60Et
Me Me	Н	H	2	H	Н	CF,	Me	SO _t Et
MeMe	H	H	2	H	Н	CF _a	Me	SPr
Me Me	н	H	2	H	H	CF ₂	Me	SOP r
Me Me	н	Ħ	2	н	H	CF ₃	N1a	SO ₂ Pr
MeMe	Н	н	2	H	H	CF,	Me	SPr-i
Mellie	H	Н	2	H	Ħ	CF,	Me	SOPr-1
Me Me	Н	H	2	H	Н	CF ₃	P/10	SO ₂ Pr-i
Ме Ме	H	Ð	2	Ħ	H	CF ₃	Mo	SBu-L
Me life	H	Ð	2	H	H	CF ₃	Mo	SOBu-t
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	ېBu-t چې
Me Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₅	Me	SCHP ₂
Me Me	ਸ਼	H	2	H	н	CF _s	Me	SOCHE,
Ma Ma	н	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CHF ₂
Ma Me	H	H	z	H	ਚ	CF3	Me	SCF ₂
Me Me	IJ	Ħ	2	H	Ħ	CF.	Me	SOCF ₃
Me Me	H	H	횐	K	H	CF,	Me	SO4CF3
Ме Ме	H	H	3	Н	H	Cr.	Me	SPb
Me Me	B	H	2	Н	H	C₽,	Me	SOF
Me Me	H	н	2	H	н	CP ₈	Me	SO ₂ Ph
Me Me	H	H	2	Ħ	н	CF _a	l-le	6СН ₃Ръ
МеМе	H	Н	2	H	Н	CF ₂	Me	Soch ₂ Ph
Me Me	H	Н	2	H	Н	CF _a	Ale	so₂сн₂рь
Me Me	H	H	2	H	H	CFg	kJe	SCH2D(=O)OE4
Ма Ме	H	Н	2	H	H	CF ₃	Me	SOCH ₂ C(=O)OEt
Me Mo	H	H	2	H	Н	CF ₃	kle	SO ₂ CH ₂ C(=0)OHt
Ma Ma	H	H	2	H	H	CF ₈	Me	SCH(Me)O(=0)OEt
Me Me	H	H	2	H	H	CF,	Me	SOCH(Mo)C(=O)OEt
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₉	Me	30,CH(Me)C(=0)OEt

[0055]

【表14】

(24)

特闘2002-308857

|--|

\mathbb{R}^{1} \mathbb{R}^{2}	R	R ⁴	n	R⁵	R	R ^{yş}	R ²⁸	R ⁵⁰
Me Me	н	Н	2	Н	H	CP,	Me	SCH2C(=O)NH2
Me Me	н	н	2	Н	н	OF;	Me	Soch_c(=0)nh,
Me Me	н	н	2	Н	н	CP ₃	Me	SO ₂ CH ₂ (!(=C))NH ₂
Me Ma	H	H	2	Ħ	H	CF,	Me	SCH _g C(=0)NHM ₀
Me Me	н	н	2	н	н	CF ₃	Me	SOCH2C(=O)NHMe
MeMe	н	н	2	н	н	CF,	Me	SO1CH1C(=O)NHMe
MeMe	н	H	8	H	Н	CF;	Me	SCH ₂ C(=0)N(Me) ₂
Me Me	H	H	2	H	Ħ	CF;	Me	SOCH2C(=O)N(Me)2
Me Mo	н	H	2	H	H	CF ₃	Me	SO1CH1C(=O)N(Mo)2
Mo Me	33	H	2	H	н	CF ₃	Me	NH ₈
Me Me	H	H	2	Ħ	£	CF ₃	Me	NHMe
Me Me	н	H	2	H	H	CF,	Me	N(Me) _q
Ma Me	H	H	2	H	H	CF,	Me	NHC(=0)Me
Me Me	Ħ	H	2	H	н	CF,	Me	N(Me)C(=0)Me
Me Me	H	H	2	H	Ħ	CF,	Me	NH5O ₂ Me
Me Me	H	н	2	H	н	CF,	Ме	N(Ne)SO ₂ Me
Me Me	H	ĸ	2	н	н	cr,	Me	NHSO ₂ CHF ₁
Me Me	H	H	2	Н	H	CF:	Me	N(Me)SO,CHF,
Me Me	Н	н	2	H	H	CF.	Me	nhso,cf,
Me Me	н	н	2	н	н	CF ₅	Me	N(Me)SO ₂ OF ₂
Me Me	н	61	2	н	I-l	CP ₈	Me	NHPh
MeMe	н	H	2	Ж	[-]	CF ₈	Me	N(Ms)Ph
Me Me	И	H	2	H	н	CF.	AMa a M	CN
Ме Ме	И	Н	2	н	н	CN	Me	CF,
Me Me	स	H	2	н	Н	CF ₈	Me	C(=0)OMe
Me Me	H	Ð	2	Н	H	CF ₅	Me	C(=0)OPr-i
Me Me	Н	Н	2	Н	н	CF ₃	Me	C(=0)OCH ₂ Ph
Me Me	н	H	2	H	H	CP,	Me	C(=O)OP&
Me Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	C(=O)NH ₈
Me Me	H	Ð	2	H	Ħ	CF,	Me	C(=0)NHMe
Me Me	Ħ	H	2	И	H	CF ₂	Me	C(=O)N(Me) ₂
Me Me	H	Ħ	2	н	Ħ	CF,	Me	C(=O)Me
Me bie	H	H	2	H	H	CF,	Me	C(=0)CP ₃
Me Me	H	H	2	Н	H	CF,	Me	C(=O)CH ₂ Ph
Me Me	H	H	8	H	H	CF,	Me	C(=0)Ph
Me Me	ਜ	H	2	H	н	CF3	Me	Me
Ne Me	Ħ	H	2	ĸ	H	Me	Ma	CF ₃
Me Me	ਜ	K	2	स	H	CF,	Me	Et
Ме Ме	ਜ	R	2	H	н	CF.	Me	P⊷i
Me Me	H	H	2	н	H	CF ₂	Me	Pr

[0056]

【表15】

(25)

特開2002-308857

			47						48
\mathbb{R}^1	R ⁴	13,3	K,	រា	R⁵	R	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁰
Me	Mo	Н	H	2	H	H	OF ₃	Me	CH ₂ OMe
Mo	Me	H	H	2	H	Ħ	CF:	Ne	CF ₃
Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₅	Me	CHF ₂
Мe	Me	н	Ħ	2	H	Ħ	CF ₉	Me	PЬ
Me	Mυ	Н	Ð	2	H	11	CF2CF5	Me	CL
Me	Me	Н	Ħ	2	H	H	CN	Me	F
Me	Me	3-3	н	2	H	Ħ	F	Ma	CN
Me	Me	н	н	2	H	Ħ	CN	Me	લ
Mo	Me	Ħ	<u>H</u>	2	Ħ	Ħ	Cl	Me	CN
ƥje	Мe	H	H	2	H	ਸ਼	CN	Me	CN
Me	Me	H	H	귈	H	H	COOMe	Me	F
Me	Li o	H	н	2	н	н	F	Me	COOMe
Me	Me	Ħ	H	2	н	Н	COOMe	Me	Cl
	Me	Н	н	2	н	Н	CI	Me	COOMe
Me	Me	Н	H	2	H	H	SO ₂ Me	Me	C)
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	Me	SO ₂ Ma
Me	kJe	н	н	2	н	И	Ph	Ма	Me
Me	Me	Н	[-]	2	H	Н	Ph	Ma	CI
Me	Me	Н	н	2	H	н	Ph	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	Н	Ph	Me	CF ₂
Me	Me	H	ы	2	H	Ħ	Pb	Ma	Pb
Me	bie -	H	Ħ	2	Ħ	H	Me	Et	ochf _z
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	OCHF2	Et	Me
Me	Me	н	Ħ	2	H	H	Me	Et	CH
Me	Me	н	Ħ	2	И	Ħ	CN	Rt	l∕-le
Me	Me	Ħ	H	2	H		Pr-i	Et	OCHF ₂
Me	Me	U	អ	2	H	H	ochf,	Et	Pr-ı
	Me	병	Ħ	2	H	H	Pr-i	Et	CM
Me	Me	뀸	н		H	H	CN	Et	Pr-i
	Me	H	£1	2	н	H	CI	Et	Cl
	Me	H	H		н		OCHF,	Et	CI
	Me Mo	H	H	2 2	H	H	CL OCHE,	Et Bi	OCHP,
	Me	H			H		· ·	Et	r carres
1	Me Me	H H	H		H H	H	CF,	Et	CF,
	Me	12	H	2	H	Н	CP _s	Et	et.
	Me	H	H			n H	C)	Et	CP ₃
i	Me	н	Н		<u>1</u>	H	CF ₂	Et	OWe
1	Me	l "	H	2	H	H	OMe	Et	CF.
ı	Me	Я	H	2	1 A	H	CF _e	Et	DEL
TATE	2410	111	1	12	XX.		lor 3		1000

[0057] 【表16】 (26)

特闘2002-308857

			49	_					50
R,	R²	R ⁸	<u>R</u> 1		Ŗ ⁵	He.	Rus	R ²⁸	R ⁵⁰
Мо	Mo	H	Н	2	H	H	O Et	Bŧ	CF ₂
Me	Mə	H	14	2	H	H	CP4	Bi	ochf2
Me	Me	Œ	И	2	Н	H	OCHF ₂	Rt	CF,
Me	Me	Ħ	н	2	H	Н	CF,	Bt	CN
Μe	Me	H	н	2	Ħ	H	CN	BL	CF,
Ме	Me	H	Н	2	Н	Н	CP ₁	Et	Me
Me	Me	H	н	2	H	H	Me	Et	CF,
Me	Me	н	н	2	н	н	Me	Pri	ochr,
Me.	Me	н	Н	2	H	н	OCHF2	Prvi	Mo
Me	Me	н	Į-]	2	н	н	Me	Pri	CN ·
Me	Me	н	н	2	н	н	CN	Pri	Mo
Me	Me	H	H		H	म	Pr-i	Pr-i	ochr.
Me	Me	н	H	2	H	н	OCHP2	Pr-i	Pr-j
Me		н	н	2	H	Н	Pr-i	Py-i	CN
Me		H	H	2	н	н	CN	Pr-i	Pr-i
Me		Ħ	H	2	H	Н	Cl		CI
Me		н	H	2	H	Н	OCHP2		ci
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	Pr-i	OCHP ₂
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	OCHF ₂	Pr-i	OCHIP,
Мe	Me	н	H	2	H	H	CF,	Pr-i	P
Me	Mo	Ħ	H	2	Ħ	Ħ	F	Pr-i	CF,
Me	Me	н	片	2	H	H	CF2	Pri	CI CI
Me	Me	н	H	2	H	H	Cl	Pr-i	CF,
Me	Me	Н	H	2	Ħ	H	CF ₃	Pr-i	OMe
Me	Me	H	н	2	н	H	OMe	Pr-i	CF,
Me		1 }	н	2	н	Ħ	CF,	Pr-i	OEL
Me	Me	Н	ഥ	2	H	Ħ	32O	Pr-i	CF,
Me	11 e	н	A	2	H	Ħ	CF,	Pr-i	OCEP ₂
Me	à-le	H	H	2	Н	H	OCHF2	Pr-i	CF ₃
Me	Me	H	8	2	н	អ	CF,	Pt-1	CN
Me	ble	ļi	Н	2	H	H	CN	Pr-i	CF3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Pr-i	Mo
Me	Me	H	Н	2	Ħ	H	Me	Pz-i	CF ₃
Me	Me	H	Н	ź	H	H	Me	Pe	OCHF ₂
3/16	Me	H	H	2	н	H	OCHF ₂	የ ፣	Me
Me	Me	н	н	2	н	н	Me	Pr	CN
Me	Me	H	н	2	н	н	CN	Pr	Me
b je	Me	н	н	2	н	н	Pr-i	Pr	OCHF ₂
Ыe	Mie	H	н	9	H	н	ochp,	P ₂	Pr-i
Me	Me	Н	Н	2	Ħ	Ħ	Pt-i	Pr	CN .

[0058]

【表17】

(27)

51

特闘2002-308857

52

\mathbb{R}^1	R ²	R ³	R	n	\mathbb{R}^5	₽¢	R ²⁹	R	R.36
Me	Me	Н	H	2	H	H	CN	Py	Pr-i
Me	Me	н	н	2	Ħ	H	o)	Pr	CL
	Me	H	H		Ħ	H	OCHF2	Pr	CI
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	C1	P7	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	OCHF2	Pr	OCHF2
Mo	Me	н	H	2	H	H	CF,	Pr	F
816	Me	н	H	2	H	H	r	Pr	CF ₃
Me	Me	H	н	2	н	H	CF.	Pt	C1
8/16	Ma	H	Н	2	H	H		Pr	CF,
Mde	Ma	H	н	2	H		-	Pr	OMe
Me	Me	н	н	2	Н			Pt	CF,
Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₂	Pr	OEt
Me	Me	H	н	2	Н	Н	OEt	Pr	CF ₂
Me	Me	Н	1-3	2	Н	Н	CF ₃	Qr .	OCHF ₂
M	Me	H	H	2	Ħ	Н	OCHP ₂	Pr	CF ₃
M	14e	H	H	2	H	H	CF.	Pr	CN
M	Mo	H	H	2	Ħ	Ħ	CN	Pr	CF,
Mk	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Pr	Me
M	Me	H	H	2	H	Ħ	Me	Pr	CF ₂
M	Me	ㅂ	Ħ	2	И	H	Me	Bu-t	P
Me	Me	H	H	2	H	a	Me	Bu-t	CI
Me	Me	H	Ĥ	2	H	H	Me	Bu-t	OCHF ₂
Me	Me	A	H	2	H	H	Me	Bu-t	CN
Me	Me	Ħ	Ħ		Ħ		cı	Bu-t	Cl
М	Me	H	н	2	н			Bu₁t	CI
Me	Me	Ħ	н	2	ਮ	H	OCHF ₁	Bu-t	OCHIF ₂
Me	Me	H	H	2	н	H	CF _e	Bu-t	H ·
•	eMe	H	H	3	H		CF _e	Bu-l	F
	Me	К	H	2	H	H	CF ₈	Bu-t	CI CI
au	Me	Н	Н	2	H	Н	Ci Ci	Bu-t	CF ₈
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu•t	OMe
	M1e	H	H	2	H	H	OMe	Bu-t	CP ₈
M	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	OEt
	Mo	H	H		H	H	OEt.	Bu-t	CF ₃
	Me	Ħ	Ħ	2	H	H	CF ₃	Bu-t	OCHF ₂
- 1	Me	Ħ	H	2	H	Ħ	CF₃	Bu∗t	CN
M	e Me	8	ří	2	H	H	CF ₃	Bu-t	Me
	e Me	Ø	Ħ	2	Ħ		Me	B u-t	CF ₃
	e Me	ਜ	H	2	H		CP ₃	Bu-s	CI
M	€ Me	H	H	2	н	H	Cl	Bu-s	C₹ ₃

[0059]

【表18】

(28)

53

特開2002-308857

R¹	R ²	K3	R'	n	₽å	·Rô	R ^{g9}	R ²⁰	R ³⁰
Me	Me	н	H	2	H	H	CF3	Bu-i	α
Me	Me	н	H	2	H	H	Cl	Bu-i	CF _s
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Bu	CI
Mo	Me	H	H	2	H	Ħ	CI	Bu	CF,
Me	Me	Ħ	Ħ	2	Ħ	Ħ	CF ₃	1-Methylbutyl	Cl
Me	Мe	Ħ	ਜ਼	2	ĸ	ਜ	CI	1-Methylbutyl	CF ₁
Me	Me	ij	н	2	H	н	CF ₃	1-Ethylpropyl	Cl
Me	Me	H	H	2	H	K	CI	1-Ethylpropyl	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	1-Pentyl	Cl
Me	l i e	Н	H	2	Н	н	Cì	1-Penty)	CF₃
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₂	1-Methylpentyl	cı cı
Me	Me	H	н	Z	Н	н	CI	1-Methylpentyl	CF,
Me	Me	H	н	2	H	н	CF3	2-Ethylbudy)	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	Cl	2-Ethylbuty)	CF ₃
Me	Me	Н	H	2	H	н	CF3	3,3-Dimethylbutyl	a
Me	Me	H	H	2	H	θ	Cl	3,3-Dunethylbutyl	CP.
Me	Ma	H	Ħ	2	H	Ĥ	CF ₃	!-Hexyl	CI
Me	Ме	B	8	2	H	8	C)	1-Hexyl	CF.
Me	Me	भ	Ħ	2	H	প্ন	CF ₃	1-Hoptyl	CI
Me	Me	Ħ	ਜ਼	2	Ħ	Ħ	CI	1-Hoptyl	OF ₃
Me	Me	H	ਸ਼	2	H	H	CF3	1-Octyl	C)
Me	Me	H	H	8	Ħ	H	CI	1-Octyl	CF _₹
Me	Me	H	H	2	H	Н	CF ₃	CU₂Ph	CI
1	Me	H	н	2	H	H	CI	CH ₂ Ph	CF,
	Mo	H	H	\$	H	H	CF₃	Pr-c	F
l l	Me	H	Ŀ	2	Ħ	н	CF ₃	Pr-c	CI
•	Me	R	H	2	H	H	CP3	Pr-c	OMe
1	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Pr-c	OCHF ₂
1	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ру-е	CN
	Me	H	Ħ	2	H	H	CF ₃	Pon-c	α
	Me	H	H	2	H	H	C1	Pen-c	CPs
•	Me	H	Ħ	2	H	H	CF ₈	Hex-c	CI
	Me	Ħ	H	2	H	Ħ	CI	Hen-c	CF ₃
	Me	Ħ	H	2	H		Me	CH₂Pr-c	OCHF ₂
1	Me	H	H	2	H	H	OCHF,	CH₂Pr-e	Me Cl
	Me	13	H	2	H	H	Cl DCHF,	CH₂Pr-c CH₂Pr-c	Ci.
	Me Me	H	H	2	2	H	a Curr,	CH ₂ Pr <c< td=""><td>OCHF₂</td></c<>	OCHF ₂
	Me	H	H	2	н	н	OCHP:	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
1	Me	H	H H	2	H	H	CF,	CH _c Pr-c	F
2414	- Inne	111	15	عد	L	1 11	101.8	LATES 1-0	<u> </u>

[0060]

【表19】

(29)

特闘2002-308857

\mathbb{R}^1	R ²	\mathbb{R}^3	R*		R ⁸	R ⁶	R ²⁹	R ^{2€}	R ³⁰
Me	Me	Н	H	8	H	H	P	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₃	CH ₂ Pr-e	CL CL
Me	No.	н	H	2	H	H	Cl	CH2Pr-e	CP ₅
Me	Ma	Я	ij	2	Ħ	H	CF ₃	CH₂Pr-c	OH
Me	Me	H	H	2	Ħ	Ħ	CF,	СЯ₂Рг~≎	OMe
Me	M2e	Ħ	В	2	Ţi	Ħ	ОМе	CH₂Pr-≎	CP ₅
Me	Мө	H	Ð	2	H	Ħ	CF,	CH ₂ Pr-a	OEL
910	Me	11	Н	2	H	н	0Et	CH ₂ Pr-c	CF ₂
91a	Me	Ħ	Н	2	И	H	CF,	CH _z Pr-c	OPr-i
Me	Me	H	Н	2	н	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr
Me	Ma	H	н	2	Ħ	H	CF,	CH,Pr-c	OBu-t
Me	Me	H	н	2	H	н	CF _u	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Pz-c
Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₂	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Ru-c
lvic	Me	H	H	2	H	Н	CF3	CR₂Pr-c	OPen-c
Me	Me	Н	H	2	H	H	CP ₁	CH ₂ Pr-c	ochp₂
Ma	Me	H	H	2	H	Н	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	CF,
Me	Mo	н	H	2	Ħ	Ħ	CF3	CH ₂ P ₇ -e	CN
Me	Me	H	Ħ	2	Ħ	Н	CN	CH _g Pr-c	CF:
Me	l-le	н	Ð	2	IJ	Ħ	CF ₃	CH₂¥r-e	Me
Me	Me	н	H	2.	H	Ħ	Me	СН₂₽г∙с	CF ₃
Me	Me	H	Ħ	2	H	E	CF ₃	1-cyclopropylethyl	CI
Me	Me	댉	Ħ	ይ	H	B	C)	1-cyclopropylethyl	CF ₃
Me	Me	ਜ	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-Methylcyclopropyi)	Ci
Me	Me	H	H	2	H	E	CI	CH ₂ (2-Methylcyclopropyl)	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	CF,	Cil _s (2,2-Dimethylcyclopropyl)	CI
Me	Me	A	H	2	И	Н	a	CH ₂ (2.2-Dimethylayclopropyl)	CF ₃
Me	Me	H	R	2	H	H	CP ₃	CH ₂ (2-Chlorocyclopropyl)	CI
Me	Me	Ħ	Н	2	Ħ	H	CI	CH2(2-Chlorocyclopropyi)	CF ₃
Me	Me	H	H	2	н	н	CF _a	CH ₂ (2,2-Dichloracyclopropyl)	Cl
Me	M≎	н	H	2	H	Н	CI	CH ₂ (2,2-Dichkarocyclopropyl)	CF,
	Me	H	H	2	H	H	CF3	CH ₂ (2-Fluorocyclopropyl)	CI
	Me	Н	H	2	Ħ	Fi	Cì	CH ₂ (2-Fluorocyclopropyl)	CP,
1	Me	Ð	Ħ	2	H	н	CP,	CH ₂ (2,2-Difluorecyclopropyl)	cı
1	Me	H	H	ż	H	H	Ci	CH ₂ (2.2-Diffuorecyclopropyl)	CP,
	Me	H	H	2	H	H	CF ₂	CH₂Bu-c	Cl
1	Me	Ы	H	2	H	Ħ	CI	CH _p Bu-o	CF,
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ Fen-c	C!
	Me	H	В	2	H	H	CI	CHgPen-c	CF ₂
1	Me	H	H	2	æ	Ħ	CF ₃	CH₂Hex-c	C!
Me	Me	H	Н	2	H	H	a	CH2Hex-c	CP ₈

[0061]

【表20】

(30)

特開2002-308857

-	

R¹	R ^y	Rª	R'	23	₽¢.	R ⁶	R ^{an}	R ⁹²	R ⁵⁾
Me Me		H	H	2	H	Н	CF2	CH₃CH₃Pr-¢	લ
Me Mo		н	H	2	Ħ	H	Cl	CH₂CH₂Pr-≎	CP ₄
MeMe		Н	H	2	H	Н	CF ₃	CH ₂ CH=CH ₁	CL
Me Mo	.	н	H	2	H	Ĥ	C1	CH2CH=CH2	CF ₆
MeMe	.	H	Ħ	2	Ħ	Ħ	CF ₃	СН₂СН=СНСІ	CI
Me Me		H	H	2	H	H	CI	сн₂сн=снс≀	CF ₁
Me Me		1-}	Н	2	H	H	Me	CH2C≡CH	ochf ₂
Me Me	. !	н	Н	2	H	H	OCHF:	CH2C≡CH	Me
Me Mis		И	લ	2	Ħ	н	Cı	сн,ссн	Cl
Me Me		И	н	Ż	H	H	ochf ₂	CH3C≅CH	C1
Mo Mo		Н	H	2	H	H	Cī	CH ₂ C≡CH	OCHF2
Me Me		Н	ы	2	Н	Н		CH₂C≡CH	OCHF ₂
Ие Ме		H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CH	r
Me Me		Н	н	2	H	H	F	CH ₂ C≡CH	CF,
Me Me		Н	н	2	H	н	CF ₃	CH₂C=CH	ପ
Me Me		н	H	2	H	Н	C1	CH ₄ C≡CH	CF,
Me Me	.	Н	H	2	Ħ	8	CF ₃	OH ₂ C=CH	0Me
Nie Me		H	H	٤	Ħ	H	OMe	Сн₂С=СН	CF ₂
Me Me		Ħ	H	2	н	H	CF3	CH ₂ C≡CH	O Et
Me Me		H	H	2	Ħ	Ħ	OEt	CH2C≡CH	CP ₃
Me Ma		H	Ħ	2	H	И	CF,	CH₂C≡CH	OCHF ₉
Me Ma		H	Ð	S	H	n	OCHF2	CH ₂ C≡CH	CF _z
Ме Ме		H	H	2	H	H	CF,	CH₂C=CH	CN
Ms Me		R	H	2	Ħ	स	CN	CH _z C≡ CH	CF ₃
Me Me		H	Ħ	2	Н	Н	CF3	CH2C=CH	Me
Mc Me		H	н	2	H	н	Me	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me Mo		H	H	2	H	н	CF₃	CHMeC≡CH	CI
Me Me	•	H	н	2	H	н	CI	CHM+C≡CH	CF,
Me Me		H	H	Z	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CMe	CI
Me Me		H	H	2	H	Ħ	Cl	CH ₂ C≡CMe	CF ₃
Me Me		H	H	2	Ħ	B	Me	()HF ₂	F
Me Me		H	H	2	Ħ	В	F	CHF ₂	Me
Me Me		H	Ħ	2	п	H	Me	CHP ₂	CI
Me Me		H	H	2	H	Ħ	Cl	CHF ₂	Мe
Me Me		н	н	2	H	ł	Me	Chr ₂	OMe
Me Me		H	Н	2	Ħ	Ħ	OMe	CHIF ₂	Me
Me Me		H	н	2	표	H	Me	CHTP ₂	OCHF ₁
Me Ma		А	Н	2	1	H	осне,	CHPe	Mo
MeMe		H	Ħ	2	ı	H	Me	CHP ₂	CN
Me Me		Ħ	Н	2	H	H	CN	CAF ₂	Me

[0062]

【表21】

(31)

特闘2002-308857

611	
v	

R	R ⁹	R3	R4	n	R [₿]	R ⁶	R ²⁹	R ^{y6}	R [®]
	Me	H	H	2	Ħ	Ħ	M≎	CHF2	Me
Me	Me	н	B	2	H	Ħ	Et	сне,	cı
M	Mu	Н	e	3	H	я	CI	Снь3	E ŧ
Me	Мe	H	H.	2	H	H	Et	CHF2	Et
Me	Me	Ħ	H	2	K	н	Pr-i	CHF:	CI
Me	Me	н	а	2	H	Н	CI CI	CHF₂	Pr-i
Ма	Me	Ħ	Н	2	Н	Н	CI	CHF2	C1
Me	Me	H	н	2	н	H	OCHF2	CIEP ₂	C1
Me	Me	H	н	2	H	Н	CI	CHF ₂	ochr,
Me	Me	н	н	2:	H	Н	OCHF2	CHF2	OCHF:
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	CI
Me	Me	Н	Н	2	H	H	CI	CHF2	CF ₂
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF2	r
Me	λfo	H	H	2	H	H	P	CHF ₂	CT ₈
Me	Ne	H	H	2	H	Ð	CF3	CHF	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe .	CHF,	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₃	CHF₃	OE1
Me	Me	H	ਖ਼	2	Ħ	H	OFt	CHF	CF ₂
Мe	Me	H	H	2	H	H	CF,	CHF ₂	OCHP ₂
Me	Ме	Н	Н	2	H	H	OCHF2	CHF ₂	CF ₅
Me	Мe	H	Ħ	2	H	н	CF,	CHF,	CN
Me	Me	Œ	Н	2	H	н	CN	CHF.	CF ₂
Me	Me	R	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	Me
Me	Me	H	H	2	R	H	Me	CHF ₂	CF;
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₃	CH ₂ CHF ₃	CI
	Me	H	н	2	H	Н	OI .	CH1CHF3	CF,
ı	Mo	H	H	2	н	H	CF3	CH _z CF _s	CI.
	Me	H	Н	2	H	H	CI	CH₂CF ₃	CF,
l i	Me	Θ	H	Ż	H	н	CFa	СН₂ОН	a
1	Me	J-)	H	2	H	н	CI	CH ₂ OH	C₹,
	Me	H	H	2	Ð	H	Me	CH ₂ OMe	OCHF,
1	Me	H	H	2	H	Ħ	OCHF ₁	CH ₂ OMe	Ne
	Мe	Ħ	H	2	H	H		CH₂OMe	ପ
	Me Ma	8	H	S 2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	CI OCHF:
	Me Me	B	н	원	н		OCHF.	CH ₂ OMe	OCHF _z
	Me	H	н	2	H		CF ₃	CH ₂ OMe CH ₂ OMe	P
		H	н	ll	H	H	ur _s V	-	CF ₂
	Me Me	H	H	2	Н	H		CH ₂ OMe	Cl.
				2			CP ₅	CH_OMe	
ME	Me	H	H	2	H	Н	CI	CH ₂ OM ₀	CF ₈

[0063]

【表22】

(32)

61

特闘2002-308857

R1	R ²	R ³	R4	a	RG	Rf	R ²⁹	R ^{sa}	R [®]
Me	Me	н	H	2	Ħ	H	CF ₅	CH ₂ OMe	OMe
Me	Mo	14	E	2	Н	H	OMe	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Ble	14	H	2	n	H	CF,	CH ₂ OMe	OEt
Me	Me	H	Ħ	2	H	Ħ	OEt	CH₂OMe	CF.
Me	Me	н	H	2	H	H	CF.	CH ₂ OMe	ochf,
A1 0	Mo	Н	Н	2	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	CF ₃
Ale	Mn	H	н	2	H	H	CF ₈	CH ₂ OMe	CN
Ме	Me	Ħ	H	2	H	H	CN	CH ₂ OMe	CF ₃
Me	Me	Ħ	H	2	Н	Н	CF,	CH ₂ OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	И	Me	CE _t OM€	CF,
Me	Me	Ħ	Į-J	2	H	H	CF,	CHI OBt	CI
Me	Me	H	н	2	H	H	CI.	CH ₂ O&t	CF3
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	сн₂сн₂он	CI
Me	Me	Н	н	2	H	H	CI	СН₂СН₂ОН	CF3
Me	Me	H	H	2	H	Н	CF ₃	CH₂CH₂OMe	CI
Mie	Me	H	H	2	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ OMe	CF _a
Me	Me	1-1	H	2	H	H	CF3	CH₂CH₂OEt	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OEt	cr.
Me	Me	Н	Н	2	H	a	CF.	CH ₂ NHM9	[CI
Me	Me	H	H	2	Ħ	A	Cl	CH ₂ NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	2	H	A	CF3	CH ₂ N(Me) ₂	Ci
Me	Me	H	Н	2	H	Ð	Cl	CH ₂ N(Me) ₂	CP,
Me	Me	И	H	2	Н	A	CF,	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	a
Me	Me	н	H	2	H	H	C1	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	CP ₃
Me	Μe	Н	a	Ż	H	H	CF.	CH ₂ N(Me)C(=O)CF ₂	a
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	CH2N(Me)C(=O)CP ₂	CF ₂
M∈	Me	Ħ	H	2	H	H	CF ₂	CH2N(Me)SO:Me	a
	Ыe	H	H	2	H	H	C!	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
	lde	B	H	2	H	H	CF,	CH ₂ N(M ₆)SO ₂ CHF ₂	(C)
	Me	R	H	2	H	H	Cī	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHF ₂	CF ₃
	Me	H	н	2	H	Н	CF ₃	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₅	C1
	Me	К	H	2	H	Н	C!	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₈	CF;
1	Me	H	Н	2	H	H	CF ₂	CH ₂ SMe	Cl
ŧ	Me	H	H	2	H	H	(I)	CH ₂ GMe	CF ₁
1	Me	Н	H	2	H	H	CP ₃	CH ₂ SO ₂ Me	a
	Me	Н	H	2	B	H	C)	CH ₂ SO ₂ Me	CF,
	Mo	В	H	2	9	н	CF ₃	CH ₂ CH ₂ SMe	CI.
	Me	H	H	Ż	H	H 	C1	CH ₂ CH ₂ SMe	C₽,
	Me	n	H	2		H	CF ₉	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CI
M	Me	Н	H	2	H	H	Cl	CH2CH29O2Me	CP,

[0064]

【表23】

(33)

63

特闘2002-308857

R ³	R ²	R	R	n	₽ē	R	R ²⁹	R	R [∞]
Me	Me	H	H	2	H	н	OF ₃	CH ₂ CN	CI
Me	Me	H	н	3	Н	н	Cl	CH₁CN	CF _s
Me	Me	Н	H	2	H	н	CF _s	CH ₂ C(=O)OMe	CI
Me	Ma	Ħ	ы	2	H	H	Ci	CH ₂ C(=0)6Me	CT ₈
Me	Me	H	н	2	H	н	CF _s	CH₂C(=O)OE(CI
Me	Me	Н	H	2	H	H	CI	CH2C(=0)OE;	¢F _ü
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	CH(Me)C(=())()Me	¢1
Me	Me	1)	H	2	H	H	Cl	CH(Me)C(=O)OMe	CF _a
Me	Me	H	H	2	H	В	CF:	C(Ma)_C(=O)OMs	Cī
Nie	Me	H	н	2	H	H	Cl	C(Me) ₂ C(=0)OMe	CF ₃
Me	Me	H	Ħ	2	H	Ħ	CF ₂	CH ₂ C(=0)NH ₃	CI
Me	Me	H	H	2	H	A	Cl	CH ₁ C(=O)NH ₁	CF2
Åle	Mo	H	н	2	Ħ	H	CF ₂	CH ₂ C(=O)NHMe	CI
Me	Mc	H	H	2	H	H	CI	CH ₂ C(=O)NHMe	CF _s
Me	Me	H	Н	2	H	H	CF3	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	O1
Ma	Me	H	Н	2	H	H	ជ	CH2C(=O)N(Me)2	CF ₅
Me	D.Se	H	H	2	H	H	cf,	CH ₂ C(=0)Me	cı
Me	Me	R	Н	2	H	H	CI	CH₂C(=O)Me	CF ₄
Me	Me	H	H	2	н	н	cr.	CH _s C(=NOMe)Mq	Cl
Me	Me	H.	н	2	H	H	CI	CH _z C(=NOMe)Me	CF2
Me	Me	H	н	2	H	Н	CP ₁	CH ₂ C(=O)CF ₈	cı .
Me	Мe	Н	н	2	H	H	CI	CH ₂ C(=0)CP ₈	CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	CP,	CH2CH2C(=0)Mo	CI .
Me	Me	H	Ħ	2	H	н	CI	CH ₂ CH ₂ C(=0)Me	CF,
Me	Me	н	H	2	H	H	Me	Pb	Me
Me	Mie	I:)	H	2	H	н	Me	Pb	F
Me	Me	Ħ	н	2	Ħ	Н	Me	Pb	CI .
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ph	OCHF2
Me	Me	Ħ	ម	2	H	H	Me	Ph	CN
Me	Me	H	В	2	H	H	Et	Ph	F
Me	Me	H	H	2	н	Ħ	Ei ,	Ph	CI
Me	Me	Ħ	H	2	Н	H	E1	ም ስ	OCHF ₂
Me	Me	я	H	2	H	H	1	Ph	CN
1	Me	B	H	2	H	н	Pr	Ph	F
	Me	H	H	2	H	H	Pr	Ph.	Cl
	Me	日	H	2	н	H	Pr	Ph	OCHT.
1	Me	H	H	2	Ħ	н	Pī	Ph	CN
	Me	H	H	2	H	н	Pr-i	Ph	F
	Me	H	Ħ	2	:	H	Pr-i	Ph	CI
Me	Me	H	Н	2	H	H	Pr-i	Ph	OCHF ₂

[0065]

【表24】

(34)

65

特闘2002-308857

\mathbb{R}^1	Rº	RA	R'	n	R ^a	Re	Rus	R ²⁸	R ³⁰
Me	Me	Н	Н	2	Н	Н	Pr-i	Ph	CN
Me	Me	H	н	2	H	H	Bu-t	Ph	Ç1
Me	Me	H	I-1	2	ĸ	H	CH ₂ OMe	Ph	Cl
Me	Me	Н	н	2	H	H	Cl	Ph	CI
Me	Me	H	н	2	Н	H	OCHF2	Ph	cı
Me	Me	н	H	2	Ħ	Ħ	OOHF2	Ph	OCBF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	CHF ₂	Ph	CI
Me	Me	H	н	2	H	Ħ	CF,	Ph	H
Me	Me	H	Hī	2	Н	H	CF ₃	Ph	Me
Me	Me	11	ਜ਼	2	ĸ	H	Me	Ph	CF _s
Me	Me	Ħ	Ħ	2	И	Ħ	CF;	PЪ	Bt
Me	Ме	И	Ħ	2	Iī	H	CF,	Ph	Pr-i
Me	Me	拼	H	2	н	Ħ	CF,	Pla	CHF2
Me	Me	Ħ	н	2	H	H	CF,	Ph ·	C F ₃
Me	Me	H	[4]	3	К	н	CF,	₽ħ	F
Me	Me	Н	H	2	н	Н	CF,	Ph	C1
Me	Me	н	H	2	H	н	C)	Ph	CF ₂
	Me	H	H	2	Н	н	CF,	Ph	OH .
Me	Me	H	ម	2	H	н	OH	Pb	CF ₃
Me	Me	н	H	2	H	Н	CF ₂	Ph	ОМе
Me	Me	H	Н	2	н	H	OMe	PL PL	CF ₃
Me	Me	н	Н	2	H	H	CF ₃	PL	OEt
Me	Me	н	H	2	H	H	OÐŧ	Ph	CF ₃
Me	Me	н	H	2	Н	H	CF ₃	Ph	OPr-i
1	Me	Н	н	2	H	н	CF ₂	Ph	OPr
Me	Me	Н	н	2	Ħ	H	CF ₃	Pb	OBu-t
Me	Me	Н	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OCH₂Pr-c
	Me	H	H	2	H	H	CF3	Ph .	OCH2CH=CH2
1	Me	H	H	2	H	B	CF,	Ph	OCH ₉ C≡CH
	Me	H	H	2	H	H	CF,	Ph	OCHE:
	Me	H	H	2	H	H	OCHF ₂	Ph	OF ₃
	Me	11	H	2	H	H	CF,	Ph 	OCH2CHF2
	Me	H	H	2	H	A	CF;	Pb	OCH4CE3
1	Me	H	Ħ	5	H	a	CF,	Ph	OCH ₂ C(=C)OMe
	Me	H	H	2	H	H	CF,	Ph	OCH(Me)O(=D)OMe
	Me	8	H	2	H	K	CF ₁	Ph	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
	Me	Ħ	Ħ	2	H	H	CF:	Ph	OC(=0)\$4e
	Me	H	H		H	H	CF,	Ph	00(=0)Et
	Me	H	H	1	H	Н.	CP,	Ph	OC(=O)CH ₂ Pb
<u>M</u>	Me	14	H	2	H	H	CF3	Ph	OC(=0)CF ₁

[0066]

【表25】

(35)

特闘2002-308857

			67						68
R'	R ²	\mathbb{R}^{s}	R4	n	\mathbb{R}^8	R¢	R2%	R ⁸⁹	R ^{so}
Me	Me	H	Н	2	H	H	CF;	Ph	OC(=O)Ph
Me	Me	H	Н	2	H	H	CF,	Ph	OSO ₂ M ₀
Me	Me	н	Ħ	2	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Et
àia	Ma	н	H	2	H	H	CF,	Ph	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	31e	ìž	H	2	К	И	CF,	Ph	oso _e cf.
Me	Me	H	H	2	н	н	CF3	Ph	OSO₂Ph
Mo	Mo	H	Н	2	H	Н	CF ₃	Ph	SMe
Me	Me	H	H	2	Н	H	CF,	Ph	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₁	РЪ	SO _t Me
Me	Me	н	H	2	Ħ	H	cf,	Ph.	Set
Me	Me	H	H	2	Ħ	Ħ	CF,	Ph	SOEt
Ме	Ме	Н	H	2	Ħ	Ħ	CF ₃	Pb ·	SOLEL
Me	Me	Ħ	Ħ	2	Ii	н	CF,	Pb	SPr-i
Me	Me	H	Ħ	٤	H	H	CF,	Ph	sop _{r-i}
Me	Me	H	H	2	H	H	CF,	Ph	SO ₂ Pr-i
Me	Мe	H	H	2	Н	H	CF ₈	Ph	SPr
Me	Me	Ħ	H	2	Н	H	CF ₁	Ph	SOPr
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF ₂	Pb	14 ₂ 08
Me	Ме	H	н	2	H	H	CF ₃	Ph	\$Bu-t
Ме	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	Ph	SOBu-t
Мe	Me	H	Ħ	2	H	H	CF3	Ph	SO ₂ Bu-t
Me	Me	H	н	2	Ж	н	CF3	Ph	schf ₂
Μe	Mo	H	H	2	H	Н	CF3	Ph	SOCHE,
Me	Me	H	H	2	H	H	CF,	Ph	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	Ħ	H	2	H		Cf ₃	Ph	NH ₂
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	CF3	Ph ·	NHMe
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₂	Ph	N(Me) ₂
Me	Мe	H	H	Ż	H	H	CF ₃	Ph.	NHC(=0)Me
Me	Мe	H	H	3	H	H	CF3	Ph	N(Ma)C(=0)Ma
Me	Мe	Ħ	H	23	Ħ	Ħ	CŁ3	Ph	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	2	н	H	CF _a	Ph	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	Ħ	ž	H	H	CF ₃	Ph	NHSO2CF2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₂	Ph	N(Me)SO2CF2
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₈	Pb	NHPh
1	Ma	H	H	2	H	H	CF _s	Ph	N(Me)Ph
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	CM
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	C(=O)Me
(le	Me	н	Đ	2	H	И	CF ₅	Ph	C(=O)OMe
1	Ме	H	Ħ	2	н	H	CF,	Ph	C(=O)NH ₂
Me	Me	H	H	2	н	Н	CP ₃	Pt	C(=0)NHMe

[0067]

【表26】

(36)

特開2002-308857

\mathbb{R}^1	R ²	R3	R	n	Ri	R ⁶	R ^{zs}	R ²⁸	R ^{so}
Me	Me	Ħ	Ħ	2	H	Ħ	CF ₃	Ph	0(=0)N(Me);
Me	Me	H	H	2	H	H	CF,	Ph	lmidezol-1-yl
Me	Me	15	H	2	ឣ	H	CF,	Ph	Pyrazol-1-yl
Me	Ne	14	Ħ	2	H	Ħ	cf,	ያክ	1,2,4-Triazol-1-yl
Ale	Me	Ħ	ਜ਼	2	li	H	CF.	Ph	1.2,4-Triszol-4-51
Мe	Me	H	स	2	Ħ	H	CF.	Ph	Tetrazol-1-yl
Ме	Мe	H	н	2	H	н	CP,	Ph	Tetrazol-5-yi
	Ме	Ħ	H	2	н	H	CP ₉	Ph	(4.6- Dimethoxypyrimidin-2- yl)oxy
Me	Me	H	Н	2	H	Н	CF ₈	Ph	(4.6- Dimethoxypyrimidin-2- ylisulionyl
Me	Me	Н	н	2	`H.	H	CF2CF3	Pb	CI
Mo	Me	Н	H	2	H	H	CF ₃	(2-C1)Fh	CI
Me	Me	Н	Ħ	2	H	Ħ	CF,	(2-F)Pb	a
Me	Me	н	H	2	H	H	CP,	(2-OMs)Ph	C1
Me	Me	H	H	2	H	H	CF3	(2-Me)Pb	CI .
Me	Me	} }	Ħ	ይ	H	H	CF ₂	(2-NO ₂)Pb	a
Me	Ме	H	H	£	H	H	CF,	(2-CN)Ph	CI
Me	Me	H	H	2	H	A	CF,	(2-C(=0)Mo)Ph	CI
Ме	Me	Ħ	H	2	H	H	CF,	(2-C(=0)0Me)Ph	OI
Mie	Me	H	н	Ż	H	អ	CF,	(2-C(=0)0Ft)Ph	CI
Me	Ме	H	H	2	H	H	CF,	(2·C(=0)0Pr·i)Ph	a
Me	Мө	H	H	2	H	H	CF:	(2-C(=0)NH ₂)PL	O)
Me	Me	H	લ	Ŷ	H	Œ	CF,	(2C(=0)NHMe)Pb	aı
Me	sh4	H	н	2	Н	Н	CF.	(2-C(=0)NMe2)FI1	CI
Me	Me	R	H	2	H	H	CF,	(3-CI)Ph	Cı
Me	Me	н	н	2	И	H	CF,	(3-F)Ph	CI
Me	ivle	н	н	2	H	H	CF ₈	(3-OMe)Ph	CI
Me	Me	н	н	2	H	H	CF ₂	(3-Me)Ph	a
Me	Me	H	Н	2	H	H	CF ₃	(3-NO ₂)Pb	CI
Me	Me	н	н	2	H	Ħ	CF _s	(3-CN)Ph	a
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=0)Me)Ph	ପ
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₅	(3-C(=0)OMe)Ph	a
Mo	NIO	H	H	2	H	н	CF _s	(3-C(=0)OEt)Ph	CI CI
Me	Me	н	H	2	Ħ	н	CF ₈	(3-C(=0)OPx-i)Ph	a
Me	Me	Ħ	H	2	Ħ	Ð	CF _s	(3-C(=0)NH ₂)Ph	cı .
Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(3-C(=0)NHMe)Ph	C1
1	Me	H	H	2	Ħ	H	CF ₃	(3-C(=0)NM6 ₂)Ph	a
Me	Мә	H	А	2	H	Ħ	Cf.	(4-CI)Ph	C!

[0068]

【表27】

(37)

特闘2002-308857

			71					V-7	72
R	R ²	R ⁹	R	n	R ⁵	R ⁶	Res	R ²⁶	R ^{SO}
	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	(4-F)Ph	CI
Me	Me	ਸ	H	2	н	H	CF ₃	(4-OMe)Ph	cı
Mo	Mu	н	н	2	Н	H	CF,	(d-Me)Ph	C1
Me	M ie	11	H	2	14	H	CF,	(4-NO ₂)Ph	Cu
Me	Me	н	H	2	н	н	CF,	(4-CN)Ph	cı
Me	Me	н	Ħ	2	н	н	CF ₁	(4-C(=0)Me)Ph	CI
Mo	Me	H	H	2	H	н	CF ₈	(4-C(=0)()Me)Ph	CI
Me	Me	H	Н	2	н	H	CF,	(4-C(=0)OEt)Ph	Cı
Ме	Me	н	н	2	H	н	CF,	(4-C(=O)()Pr-i)Ph	CI CI
Me	Me	н	н	2	н	н	CF.	(4·C(=0)NH ₂)Ph	C1
Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₂	(4.C(=0)NHMe)Ph	Cl
Me	Me	н	Н	2	н	н	CF ₂	(4-C(=0)NMe ₂)Ph	CI
Me	Me	н	H	2	Ħ	н	CF3	Pyrmidin-2-yl	CI
Me	Me	ਸ	Ħ	2	H	H	CL2	4,6-Dimethoxypyrmidin-2-yl	C1
Ale	kie	H	Ħ	2	H	H	CF,	Thiophen-2-yl	a
Me	Мe	H	H	2	H	H	CF3	Puran-2-yl	CI
Me	Me	H	Ħ	2	n	E)	CF ₃	SO ₂ Me	(CI
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	CF₃	80,B:	CI
Me	Me	H	H	2	Н	A	CF ₂	SO ₂ Pr-i	[CI
Me	Me	H	H	2	ы	B	C∄³	SO,CH.Ph	CI
Me	Me	H	Н	호	ŀΕ	Ħ	CF,	SO,CHF2	CI
Me	Me	Ą	Ħ	2	Ħ	IJ	CF ₈	SO ₂ CF ₈	CI
Me	Me	н	Ħ	[2]	H	प्त	CF,	so.Ph	CI
Me	Me	Ħ	[4	2	H	H	CF ₃	C(=0)Me	CI
Me	Me	ਜ	Ħ	2	н	H	CF3	C(=0)Et	CI
Me	Me	H	H	2	н	R	CF ₈	C(=0)Pr-i	C1
Μs	Me	H	H	2	H	Н	CF,	C(=O)Eu-1	CI
Me	Me	H	H	2	H	Ð	CF,	C(=O)Ph	a
Me	Me	Ħ	H	ષ્ટ	Ħ	FI	CF ₃	C(=0)CH _t Ph	a
Me	Me	H	H	2	H	Н	CF ₃	C(=O)CH,CL	a
1	Me	H	И	2	Ħ	Ħ	CF ₂	C(=O)CHCl2	CI
	Me ·	Я	H	٤	H	H	CF ₃	C(=0)CF ₈	a
	Me	Н	H	2	14	H	CL ³	C(=O)OMe	Cs .
	Me	H	H	2	Ħ	Ħ	CF ₃	C(=O) OP b	CI
	Me	H	H	2	H	H	CF _e	C(=O)OCil _e Ph	Ci
1	Me	н	R	2	H	B	CF ₃	C(=O)NHMe	CI
1 .	Me	H	H	2	H	표	CF ₃	C(=0)N(Me)2	CI
	Me	H	H	2	H	ਸ	CF ₅	C(=0)NHPh	CI
	Me	ਸ	H	2	H	H	CF3	NH ₂	CI
Mi	Me	H	Ħ	2	R	H	CI	-(CH ₂);	₁ O-

[0069]

[表28]

(38)

特開2002-308857

			73					(30)	74
R1	R ²	\mathbb{R}^{8}	R	n	R ⁶	\mathbb{R}^6	R ²⁵	R ²⁶	R ^{ao}
Me	Me	H	H	2	Н	H	Cl	•(CH ²)3C	
Me	eM	H	H	2	н	Н	Cl	-(c,H:2)-	
Me	eM	н	Н	2	н	Н	Cl	-(CH ₂),SC) ₂ -
Me	Me	H	Ħ	2	Ħ	H	CF ₃	-(CH ₂) ₂ C	
Me	Me	Н	H	2	н	H	CF.	·(CH ₂) ₂ C).
Me	Me	н	H	2	H	H	CF,	·(CH ₂) ₂ 9	
Me	Me	H	H	2	H	H	CF;	-(CH₂)₃€() _{\$} -
Me	ble	H	Ð	2	Ħ	H	OMe:	-(CH ₂ j ₄ :	
Me	ð Ío	H	Ħ	2	Ħ	H	OCHF2	-(CH ₂)-	•
н	ਮ	H	H	2	H	H	CF,	Me	CI
Me	H	Ħ	Н	Z	ĸ	н	CV:	Me	Cl
Me	H	Me	H	2	H	H	cf,	Me	લ
Me	Me	Me	ĸ	ષ્ટ	Ħ	H	CP ₃	Me	CI
Me	Me	H	н	2	Me	H	cr,	Me	C1
Me	Me	Н	Н	2	Et	н	CF,	Me	CI
Me	Me	H	н	2	Py-i	Н	CF,	Me	CI
Me	Me	H	H	2	Me	Me	CF ₈	Me	C1
Me	Et	Н	H	2	H	н	CF,	Me	C1
Et	Et	Н	н	2	H	H	CF,	Me	C)
Me	Pr-i	н	H	2	H	H	CF.	Me	C)
Me	Pr	н	н	2	31	EĮ	CF ₃	Ma ·	CI CI
Mie	Pr-c	H	Ħ	2	н	H	CF3	Me	a
Me	CH ₂ Pr-c	11	EH	2	H	£ 1	CF,	Me	CI
Γ.	-(СН ₂₎₁ -	H	8	2	H	8	CF,	Ma	C1
١.	-(CH ₂),-	H	H	2	Ħ	ਸ	CF,	Me	CI
١.	-(CH ₂)	H	H	2	U	ਜ਼	CF,	Me	CI
	-(CH ₂) ₅ .	ਜ਼	н	2	H	H	CF _t	Мe	CI
H	, -		н	2	H	H	CF ₈	Me	CI
H	-(CH,) ₄ -	Н	2	H	H	CF,	Me	CI
H	-(CH,)5-	H	2	H	H	CF,	Mo	CI
H	-(CI),	λ ₂ -	н	2	н	н	CF,	Mo	a
Me	Me	н	н	Įı	H	H	CI.	ĸ	Cl
Me	Me	н	H	1	н	H	ochf,	н	CI.
Me	Me	H	H	1	H	H	ochf,	H	OCHP ₂
Mo	Me	н	Н	1	Ħ	н	CHF2	H	CI CI
Me	Me	H	H	1	Ħ	Ħ	CF ₃	н	F
	à le	н	H	1	H	н	CF ₃	н	(cı
Me	Me	H	H	l	H	H	CF ₈	н	OME
	Me	Ħ	Ħ	l	H	H	CF,	н	OEt
Me	Ме	Ħ	H	1	H	H	CF ₂	н	OCHF ₃

[0070]

【表29】

(39)

75

特闘2002-308857

R	R ²	R ⁵	R,	n	R ⁵	K.	S _{rb}	R ²⁸	R ^m
Me	Me	Н	H	3	H	H	CF,	н	СИ
Me	Me	н	н	1	H	н	CF ₃	ж	Ma
Me	Me	H	H	1	H	11	H	Me	Cl
Me	Me	H	H	1	A	H	Me	Me	Me
Me	Ma	Н	H	1	H.	н	Me	Me	cı
Me	Ma	Ħ	9	1	Ħ	변	C1	Me	Me
Me	Me	Н	H	1	H	н	Ľt .	Me	CI
Me	Me	ĸ	B	1	K	H	CI	Me	Et
Me	Me	H	H	1	Н	н	Pr-i	Me	cı .
Me	Me	H	Ħ	ı	н	н	CI	Me	Pr-i
Ме	Me	H	н	1	н	Н	But	Me	C1
Me	Me	H	н	1	н	Н	CI	Ale	Bu-t
Me	We	Н	Н	ı	H	Ħ	CI	Me	CI
Me	Me	H	H	1	H	ਸ	CHF ₂	Me	CI CI
Me	Me	Ħ	Ħ	1	H	H	C)	Me	CHF ₂
	Me	Н	н	1	Đ	н	OCHP ₂	Me	H
	Me	H	H	1	H	H	OCHP2	Me	CI
	Ме	H	н	1	H	H	Cl	Me	ochf.
	Mie	H	H	1	H		OCHP ₂	Me	OCHF ₂
	Me	H	Н	1	H	H	CP,	Me	H
	Me	Н	H	1	п	н	CF,	Me	CI
Me	Me	H	Ħ	1	И	A	C)	Ma	CF ₃
1	M9	H	H	1	H		CF,	Me	P
	Me	В	H	1	H	В	<u> </u>	Me	CF ₂
	Me	Ħ	Гī	1	H	H		Me	OH
	Ме	ਜ਼	H	1	H		он	Me	CF ₃
	Me	н	H	1	H	H	CF,	Me	OMe
ŀ	Me	Н	ŀi	£	н		OMe	Me	CF ₃
	Me	H	H	ı	H	1 :	•	Me	OEt .
1	Me	H	H	ŗ	H	н	OEX:	Mo	CF₃
	Me `	H	H	1	H	H	CF ₅	Me	OPr-i
ł	Me	H	Н	1	H	H	CF₃	Me	OPr
1	Me	H	Н	1	H		CF ₃	Me	QBu-t
1	Me	H	Н	1		H	CF ₃	Me	OBu-s
	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	OBu-i
1	Me	Я	H	1	H	Н	CF,	Ma	OBu
	Me	H	H	1	H	11	CF ₃	Mo	O(2-Pen)
	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Ме	O(3-Pen)
	Me	H	H	1	H	H	CF,	Me	OPen-a
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	O(2-Hex)

[0071]

【表30】

(40)

特闘2002-308857

			77					,	78
\mathbb{R}^1	R	R³	Rf	ก	Rb	R ⁶	R ^{go}	R ²⁸	R ^{so}
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	CF2	Me	O(3-Hex)
Me	Me	H	ਸ	3	H	H	CF:	et4	OHex-a
Me	Me	H	н	3	H	H	CF ₃	Me	OPen-c
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	CF ₃	Me	Oliex-c
Me	Me	Ħ	Ħ	1	H	H	CY:	Me	OCH₂Pr-c
Me	Me	н	H	1	Ħ	H	CF:	Me	OCH₂Bu-c
Me	Me	Н	H	1	H	H	CP3	Me	OCH ₂ Pon-c
Me	Mo	н	н	1	Ħ	H	CP,	Me	OCH _e Hex-c
Me	Me	H	H	1	H	H	CF,	Me	och,ch=ch,
Ma	d le	Ħ	Ð	1	H	H	CF,	Me	OCB,C⇒CH
Ma	Ma	H	н	1	н	H	CF,	Me	ochp,
Me	Me	Ħ	н	1	H	Н	OCHF2	Me	CP _s
Me	Me	H	H	1	н	H	CF,	Me	OCH, CHF,
Me	Me	н	H	1	н	н	OCH _S CHP ₂	Me	CF ₂
Me	Me	н	н	1	н	H	CF,	Me	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	н	1	Н	н	OCH ₂ CF ₃	ble	CF ₃
Me	Иe	н	н	1	н	Ħ	CP,	Me	OCH ₂ CN
Me	Me	H	H	1	Н	H	CF.	Me	OCH ₂ C(=0)OEt
Me	Me	H	H	3	н	H	CF ₃	Me	OCH(Me)C(=O)OEt
Me	Me	Ħ	Ħ	1	н	H	CF.	Me	OCH2O(=O)NH2
Me	Me	н	н	1	H	H	CP _s	Me	OCH ₂ C(=O)NHMe
Me	Me	н	Н	1	H	H	CF ₃	Ale	OCHrC(=O)N(Me)-
Ma	Mie	н	н	1	Я	H	CF ₃	Ma	осн,рь
Me	Me	н	н	1	H	H	CF ₅	Me	OPh
Me	Me	Ħ	Ħ	1	н	H	CF,	Me	O(2-Cl)Ph
Me	Me	н	អ	1	H	H	CF,	Mo	O(2-Br)Ph
Me	Me	H	Я	1	Ħ	Ħ	CF ₃	Mc	O(2-F)Ph
Me	Me	H	н	1	H	Ħ	CF₃	Me	O(2-Me)Ph
λie	Me	H	H	1	Ħ	Н	CF,	Me	O(2-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	A	CE3	Me	O(2-NO ₂)Ph
Me	Me	Ħ	H	Ł	Ħ	H	CF ₁	Me	O(2-CN)Ph
Me	Me	ਜ	н	Ł	н	H	CF,	Me	O(2-C(=0)OMe)Ph
Me	Me	H	H	ı	H	H	CF,	Me	O(8-C1)Ph
Me	Me	H	н	ı	H	н	CF ₂	Me	O(8-Br)Fh
Me	Me	H	H	ı	Н	H	CF ₂	Me	O(6-F)PL
Me	Me	H	H	ı	Ħ	A	CF3	Me	()(3-Me)Ph
	Me	Ħ	Ħ	ı	H	H	CF,	Me	O(S-OMe)Ph
Me	Mo	н	H	ı	H	Ħ	CP ₃	Me	O(S-NO ₂)Ph
Me	Me	(·)	н	1	H	Ħ	CF,	Me	O(S-CN)Ph
Me	Me	H	Н	1	H	H	CP ₃	Me	O(S-O(=0)OMe)Ph

[0072] [數31]

(41)

特闘2002-308857

\mathbb{R}^{1}	R ²	R3	R	n	R⁵	R	R ²⁹	R ²⁰	R ²⁰
Me	Me	Н	ਸ	נ	H	H	CP,	Me	O(4-CDPh
Me	Me	н	н	1	H	H	CF ₃	Me	O(4-Br)Fh
Me	Me	н	н	3	Ħ	H	CF ₃	Me	O(4-F)Ph
Me	Me	н	F)	1	H	ij	CF ₉	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	H	н	1	H	H	CF,	Me	O(4-OMe)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF,	Me	O(4-NO2)Ph
Me	Ma	H	H	1	H	H	CF ₂	Me	0(4-CN)Ph
Me	die 💮	H	띪	1	Ħ	Ħ	CF,	Me	O(4-C(=0)OMe)Ph
Ma	Me	H	н	1	Ħ	H	CF:	Me	OC(=0)Mo
Me	ð.ía	H	н	1	н	H	cf,	Me	OC(=O)Et
3/10	Me	н	н	1	H	н	CF,	Me	OC(=O)CH ₂ Pb
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	CF,	Me	OC(=0)CF,
Me	Me	H	H	1	H	н	CP ₃	Me	OC(=O)Ph
Me	Me	н	н	ı	Н	H	CF,	Me	OSO ₂ Me
Me	Me	н	H	ı	H	H	CF,	Me	OSO₂Et
Me	Ме	н	н	3	H	И	CP ₃	Me	OSO ₂ CH ₂ Ph
Me	Me	H	F	1	Ħ	Ħ	CF ₈	Me	OSO _z CF ₃
Me	Me	Н	Ð	1	Ħ	H	CF,	Me	OSO₂Ph
Me	Me	H	н	1	Ħ	н	CF,	Me	SMe
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	CF3	Me	3O₁Me
Me	Me	H	Ħ	1	Н	n	CF ₃	Me	SEt
Me	Me	H	13	1	H	빒	CF ₃	Me	SO ₂ Rt
Me	Me	H	H	1	H	Ð	CF,	Me	SPc
Me	Me	H	a	1	ŀſ	E	CF;	Me	SO _p Pr
Me	Мe	H	H	1	H	IJ	CF ₃	Me	SPr∙i
Mе	Me	Ħ	Ħ	1	Ħ	H	CF;	Ma	SO ₂ Pz·i
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	CF.	Me	SBu-t
Me	Me	H	н	1	H	H	CF.	Me	SO₂Bu-t
Мe	Ме	H	н	1	Н	н	CF,	Me	SCHF ₂
Me	Me	H	H	ı	Ħ	Ħ	CF,	Me	SO ₂ CHIF ₂
1	Me	н	H	ı	Н	H	CF ₈	Me	SCF.
	Me	ĸ	Н	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CF ₂
	Me	H	Н	1	H	Н	CF,	Me	SPG
	Me	H	H	1	H	H	CF ₅	Me	so,ph
	Me	H	H	1	Ħ	H	CF ₃	Me	SCH ₂ Ph
	Me	H	H	1	H	H	CF ₅	Me	SO,CH ₂ Ph
	Mo	H	H	1	ы	н	CF3	9-la	SCH_C(=0)OEL
1	Me	H	H	1	H	13	CF ₉	Me	SO ₂ CH ₂ C(=0)OEt
	Me	H	H	1	H	Ħ	CF,	Mo	SCH(Me)C(=0)OEt
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	Me	SO ₂ CH(Me)C(=0)OEt

[0073]

【表32】

(42)

特開2002-308857

83

R	R ²	R3	R'	2	R^{i}	R.ª	R ²⁰	R ²⁸	R ^{so}
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	CF,	Me	SCH₂C(=O)NH₂
Me	Me	11	H	ı	Н	H	CF,	M∌	SO ₂ CH ₂ C(=0)NH ₂
Me	Me	н	H	1	н	H	CF,	Me	8CH4C(=O)NHMa
Me	Me	H	H	ı	H	н	CF ₁	Me	SO2CH8C(=0)NHW#
Me	die	ħ	Ħ	1	Ħ	Н	CF.	Me	SCH2C(=O)N(Me)2
Me	Ma	H	Ħ	1	н	Ħ	CP _z	Me	\$O ₂ CH ₂ C(=0)N(Me) ₂
Mie	Mo	H	H	1	н	н	CF ₈	Me	NH ₂
Me	Me	H	н	1	н	н	CF,	Me	NHMe
Me	Me	H	н	ı	н	H	CF ₃	Me	N(Me) _e
Ме	Me	Н	н	1	н	Н	of,	Me	NHC(=0)Me
Me	Me	Н	Н	1	H	Н	CF ₂	Me	N(Me)C(≃O)Me
Me	Me	н	H	1	H	H	CF ₅	Me	NFISO ₂ Me
Me	Me	Н	Ħ	1	H	Ħ	CF ₂	Me	N(Ma)SO _c Me
Me	Me	н	н	2	н	Ħ	CF ₃	Me	NHSO ₂ CHF ₂
Ме	Иe	H	н	1	Ħ	н	CF ₃	Me	N(Ma)SO ₇ CHF ₂
Мe	Ме	H	н	1	14	Ħ	CF ₅	Me	nhso ₂ cf ₈
Me	Me	H	Ħ	1	И	EI	CF,	Me	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Me	H	H	ı	H	R	CF,	Mo	NHPh
Ме	Me	н	H	ı	Ħ	H	CP,	Me	N(Me)Ph
Me	Me	ਜ਼	H	Ł	H	H	CF,	Me	CN
Me	Me	B	H	ŧ	H	H	CN	Ma	CF ₂
Me	Me	H	Н	ı	H	H	CF.	Ma	C(=O)OMe
Me	Me	H	H	Ł	И	H	CF,	Me	С(=0)ОСН,РЬ
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	CF,	Me	C(=0)0Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF _s	Me	C(=O)NH ₂
Me	Ме	K	н	L	H	H	CF,	Me	C(=O)NHMe
Me	Me	H	н	ı	н	Н	CF ₂	Me	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	[·]	ı	H	Н	CF ₃	Me	C(=O)M(e
Me	Me	H	Н	l	H	H	CF ₃	Mo	C(≃O)CF ₃
Мe	Ме	H	H	1	H	H	CF ₃	Mo	C(=O)CH2PF
Me	Δte	н	н	1	H	H	CF _s	Me	C(=O)Ph
Me	Me	н	Н	1	H	H	CF ₃	Me	Me
Me	Mo	н	Ħ	1	Ĥ	H	Ma	Me	CF,
Me	Mo	H	H	1	Ħ	H	CF ₈	Ме	Ct Ct
	Me	H	H	1		Ħ	CF ₂	Ме	Pr-i
1	Me	H	H	ı	H	H	CF ₅	Ме	Pr
1	λáe	H	H	1	Ħ	H	CF ₃	Me	CH ₂ OMe
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	CF.	Me	CF ₃
	Mie	Ħ	Ħ	1	9	H	CF,	Ме	CHF ₉
Me	Me	Н	Н	h	H	H	CF ₃	Me	Pb

[0074]

【表33】

(43)

特闘2002-308857

								(43)	付給とリリン
			83						84
R'	R²	Rª	R'	n	R ⁵	R"	R ^{2a}	R ^{za}	R ²⁰
Me	Me	н	н	3	Ħ	31	CP7CF8	Me	CI CI
Me	Me	н	H	1	н	н	Ph	Me	Me
Me	Mo	н.	H	1	H	H	Ph	Me	cı
Me	Me	н	н	ı	H	H	Ph	Me	ORt
Me	Me	H	A	1	H	Ħ	Ph	Me	CF4
Me	Me	н	a	ایا	H	Ħ	Ph	Ме	Ph
	Me	Н	В	lı l	H	Ħ	C)	E:	cı
	Me	H	H	1	Ħ	H	OCHF ₂	a.	CI
	Me	H	ĸ	1	H	! {	CI	Et	OCHF ₂
Me	Me	Ħ	н	1	н	н	OCHF2	E1	OCRP ₂
Me	Me	н	н	1	H	н	CF ₃	Ει	F
Me	Me	н	Ħ	1	H	H	F	Eı	CF.
Me	Me	Н	н	1	H	H	CF,	₽.	C1
Mo	Me	Н	н	1	H	H	CI	Ct	CF3
Mo	Me	н	н	1	H	н	OP₃	Eì	OMe
Me	Me	н	H	1	H	H	OMe	Eŧ	CF ₂
Me	Me	Н	н	1	H	H	CF ₃	£;	OEt
Me	Me	н	н	1	H	Ы	OEt	E:	CF,
Me	Me	н	н	1	Ħ	н	CF ₂	Et	ochf ₂
Me	Me	Н	н	1	H	н	OCHF2	Et	CF:
Me	Me	Ħ	Ħ	1	Zi	н	CF,	Et	CN
Me	Me.	H	Ħ	1	IJ	H	CN	En	CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	н	CF ₅	Et	Me
Me	Me	ਸ਼	H	1	H	H	Me	Et	CF,
	Me	н	Ħ	i	H	Ħ	c)	Pr-i	ca e
	Me	н	н	1	H		OCHF ₂	Pr-i	a
Me	Me	용	H	1	H	H	CI	Pr-i	OCHF ₂
M	Me	H	Ħ	ì	н	Н	OCHF2	Py-i	OCHF ₂
M	Me	H	H	ı	H	H	CF,	Proi	₽
λio	Me	е	H	ı	н	и	F	Pri	CF,
Mie	Me	H	H	ı	н	в	CP.	Pr-i	CI
Me	Me	ĸ	H	ı	R	н	cı	Pr-i	CF,
Me	Me	н	Н	Ιt	н	H	CF3	Pr-i	OMe
Me	Me	H	И	ι	H	H	OMe	Pr-i	CF,
Me	Me	H	H	L	H	H	CF.	Pe-i	OEst
M	Me	н	Н	լլ	H	H	O®:	Pr-i	CF ₃
100	e Me	H	H	1	н	H	CF ₃	Pr-i	OCHF2
M	Me	H	н	1	표	Ħ	OCHT,	Pr-i	CF,
M	Ме	H	Ħ	1	Ħ	Я	CF ₃	Pr-i	CN
1.,	lac.	İ .,	١,,	١.	, Ta	1.	las:	n :	OF.

【表34】 [0075]

(44)

特闘2002-308857

~-
Xr.

Ri	R²	\mathbb{R}^3	\mathbb{R}^{t}	n	\mathbb{R}^5	Re	R ²⁹	R ^{at}	P ₂₀
	Me	H	H	1	Ħ	Ħ	CF,	Pr-i	Мо
Me	Me	H	Ħ	1	Ħ	H	Me	Pr-i	CP ₁
λŧe	Me	н	H	1	H	H	Cì	Pr	Cl
	Me	н	H	1	H	Ħ	OCHF.	Pr	cı
Me	Me	H	H	1	H		CI	Pr	OCHP ₂
	Μe	H	H	1	H	H	OCHF2	Pr	OCHF2
Me	Me	H	А	1	H	H	CF,	Pz	P
Ma	eld.	H	н	1	H	H	F	Pe	CF,
1	Me	Ħ	H	1	H		CF,	Pr	CI
1	Me	H	н	1	Н	H	CI	Pr	CF,
•	Ma	H	H	1			CF.	Pr	OMe
	Me	H	H	1	H		0Me	Pr	CF ₂
	Mo	H	н	1	H	н	CF ₂	Pr	OEt
	Me	н	H	1	H	H	0Et	Pr	CF;
	Me	н	H	1	H		CF ₁	Pr	OCHF ₂
	B1e	H	H	1	H	Ħ	OCHT ₂	Pr	CF ₃
Mo	Me	н	н	ı	H	H	CF ₃	Pr	CN
3.10	Me	H	н	3	H	H	CN	Pr	CF,
Me	Me	14	H	1	H	Ħ	CF ₃	Pr	Me
Me	Me	莳	Ħ	1	И	H	Me	P7	CIF,
	Me	Ħ	ដ	1	H	H	C)	Bu-t	a
	Me	H	Ħ	1	H	1 1	OCHF ₂	Bu-t	ପ
1	Me	H	H	ĵ	H	B	OCHP ₂	Bu-t	ochr,
Me	Me	H	H	J	H	H	CF ₃	Bu-t	и
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₂	Bu-t	F
Me	Me	Н	H	1	H	в	CF ₃	Bu-t	a
	Me	H	H	1	H	H	CI	Bu-t	CP ₃
	Me	я	H	1	H	H	CF.	Bu-t	OMe
	Me	A	H	ì	Н	Ħ	OMe.	Bu-t	CF ₃
1	Me	Ħ	H	ī			CF,	Br-t	OEt
	lde	H	Н	1	Н	H	OEt	But	CF ₃
	Me	H	Н	Ч		H	CF ₃	Bu-t	OCHF ₃
	Me	H	H	1	Ħ	H	CF ₂	Ba-t	CM
	Me	н	Н	1	H	H	CF ₃	Bu-t	Mo
	Me	H	H	1	H	H	Me	Bu-t	CF,
	Me	[:]	H	1	H	H	CP3	Bu-s	Cl
1	Me	[:]	H	3	H	н	C!	Bu-s	CF3
	Me	н	H	1	H	н	CF ₈	Bu-i	a
	Me	H	H	1	H	H	Ci	Bu-i	CF,
Mo	Me	Н	H	1	H	H	CF ₈	Bu	Cl.

[0076]

【表35】

(45)

特開2002-308857

								(=)	12001 C (1 (1 C)
			87						88
R۱	R ²	R3	R.	U	Rā	R ⁶	R ²⁹	R28	R ^{eo}
	Me	H	н	1	H	н	Cl	Bu	CF ₅
Me	Me	Н	H	1	н	н	CF3	1-Methylbutyl	C1
Me	Me	Н	H	1	Н	H	CI	1-Methylbuty1	CF ₁
Me	Me	н	н	2	H	н	CF,	1-Ethylprapyl	a
Me	Me	H	Н	1	H	H	Cl	1-Ethylpropyl	CF.
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	CF,	1-Pentyl	Cì
Me	Me	H	H	1	H	Ĥ	Cl	1-Pentyl	CF,
Me	Me	H	Ħ	1	Ħ	Ħ	CF ₂	1-Methylpentyl	CI CI
M	Ma	Ħ	H	1	H	ĸ	Cl	1-Methylpontyl	CP,
Ma	Me	H	H	1	н	H	CF,	2-Ethylbutyl	CI.
Me	Me	H	ß	1	H	H	cı	2.Ethylbutyl	CF ₂
Me	Me	я	Н	Т	Н	H	CF,	3,3-Dimethylbutyl	CI CI
Me	Me	H	Н	1	H	H	CI.	3,3-Dimethylbutyl	OF,
Me	Me	H	н	ı	Н	H	CF ₅	1-Hexyl	C1
Me	Me	Н	H	1	Н	Н	Ci	1-Hexyl	CP ₃
Me	Me	Н	н	1	Н	H	CF,	1-Heptyl	C1
Me	Me	H	н	1	н	H	CI	1-Heotyl	CF4
Me	Me	H	н	1	H	Н	CF:	1-Octyl	Cı
Me	Me	н	н	1	H	н	CI	i-Octy)	CF _*
Me	Me	H	Н	1	H	н	CF ₂	CH ₂ Ph	C)
Me	Me	Н	H	1	H	H	CI	CH _t Ph	CF ₃
Vie	Me	И	H	3	н	н	CP.	Pr-e	CI
Me	Ме	И	Н	1	H	н	CF.	Pen-e	CI
Ne	Me	н	н	1	H	H	CI	Pea-e	CF.
Me	Wie	н	н	1	H	н	CF,	Hex-c	cı
Me	Me	Н	н	1	H	н	C1	Hex-c	CF,
Me	Me	H	Ħ	1	H	Н	C1	CH ₂ P ₂ ·c	a
Me	Me	Ħ	Ħ	1	Ħ	H	OCHF2	CH ₂ Pr-c	a
λfe	Me	Ħ	Ħ	1	H	Ħ	CI	СНьРес	ochr,
	340	H	H	1	Н	H	OCHF,	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
	Me	H	H	1	H	H	CF,	CH ₃ Pr-c	F
	Me	H	H	3	H	H	F	CH ₂ Pr-c	CP3
	Me	Ð	H	3	H	H	CF,	CH ₂ Pr-c	CI
	Me	Н	H	1	Н	H	a	CH ₂ Pr-c	CF,
	Me	Ħ	Ħ	L	Ħ	Н	CF₃	CH ₂ Pr·c	CN
	Me	Ħ	Ħ	Ė	H	К	Cf,	CH ₂ Pr·c	Off
	Me	H	H	1	H	H	CP.	CH ₂ Pr·c	Ohie
	Me	H	Ð	1	Н	H	OMe	CH ₂ Pr-c	CF ₂
Me	Me	H	H	Ľ	H	H	CF,	CH _s Pr-o	OEt
34.	12.6-	**			1 47	1 77	LOTA	CHT D	OB

CH₂Pr-o

CF3

[0077] [氨36]

(45)

特闘2002-308857

R	R²	R3	R+	a	R ⁵	₽¢	R20	R ²⁸	R ⁵⁰
	Me	H	Ħ	ì	H	Ħ	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OPr-i
Me	Me	н	н	1	H	Н	CF ₃	CH ₂ Pr-e	OP ₇
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OBu-t
Me	Me	ы	H	1	H	H	CF,	CH ₂ Pr-e	OCH_Pr-c
Me	Me	н	H	1	H	Ħ	CF.	CH₂Pr-e	OCH _z Bu-e
Me	Mo	H	H	1	H	Ħ	CF,	CH₃Pr-¢	OPen-c
Me	Mo	Hì	H	1	H	H	CF,	CH ₂ Pr·c	OCHP,
₽/ic	Me	H	H	1	H	Ħ	OCHF ₂	CH ₂ Pr-c	CF ₂
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	CF,	СН ₂ Ре-с	СИ
Me	Mo	H	H	1	н	H	CN	СН₂Рг-≎	CF ₁
Me	Me ·	H	н	1	ĸ	H	CF3	CH ₉ Pr-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	CH ₂ Pr-c	CF ₃
Me	Me	н	H	1	Ħ	H	CF,	i-cyclopropylethyl	cı
Me	Me	н	H	1	H	H	a	1-cyclopropylethyl	CF ₃
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₃	CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl)	CI
Me	Me	H	н	1	н	н	CI	CH ₂ (2-Methyl-cyclopropy))	CF ₃
Me	Me	H	E	3	H	Н	CP,	$CII_2(2,2-Dimethyl-cyclopropyl)$	Cl
Me	Ме	Н	Н	1	H	H	CI	CHz:2.2-Dimethyl-cyclopropyl)	CF,
Me	Me	Н	н	1	н	H	CF ₃	CH ₂ (2-Chloro-cyclopropyl)	CI
	Me	н	H	4	H	H	C1	CH _z (2-Chlero-cyclopropyl)	CF ₂
Me	Me	H	н	1	н	Н		CH2(2,8-Dichloro-cyclopropyl)	CI
Me		н	н	1	H	H			CF,
Мо	Me	H	н	1	Ħ	Н		CH ₂ (2-Pluoro-cyclopropyl)	cı
Me		Н	ы	1	Ħ	Н	Cl	CH ₂ (2-Fluoro-cyclopropyl)	CF,
Me		H	Ħ	1	H	Н			CI
Me		H	н	1	H	H		(:H ₂ (2,2-Difluoro-cyclopropyl)	CF,
Me		H	H	1	Ħ	- 1	-	CH ₂ Bu-c	CI
Me		н	H	1	H	E)		CH ₂ Bu-0	CF ₂
Me		н	Ħ	1	H	H	- 1	CH ₂ Pen-3	CI
Me		11	H	1	Ħ	ŀ			CF ₃
Ме		H	Н	1	H	- 1		CH ₂ Həx-c	CI
Me		H	H	1	H	1		CH ₂ Hex-c	CF ₂
Me		H	H	1	H			CH ₂ CH ₂ Pr-c	CI
Me		H	H	1	H				CP ₃
Me		H	H	1	H				01
Me		H	H	1	Ħ	H	,	CH ₂ CH=CH ₄	CF ₃
Me Me		H	H	1	Н	K		CH ₂ CH=CHCI	CI CI
1 1		[i]		1	H	H		CH ₂ CH=CHCI	CF _s
Me Me		H	FI H	1	H			CH_C=CH	C1 C1
تعدسا	1110	1.7	11	<u>''</u>	21	1.7	OOME!	CH2C=CH	(vi

[0078]

【表37】

(47)

特闘2002-308857

								` '	付照るサリる
			91						92
R		R.ª				Re		R ²⁰	R ³⁰
	Me	н	H			1	CI	CH,C≡CH	OCHP,
	Me	H	3	լ	H	H	OCHF ₂	CH₁C≡CH	ochp,
	Me	H	H	1	H	H	CF.	CH•C≡CH	F
	Me	H	H	1	H	H	F	CH³C≡CH	CF.
Мe	Me	H	H	1	H	H	CF,	CH ₂ C≡CH	CI.
1k	Me	н	H	1	H	H	C)	CH ₂ C≡CH	CP,
Ие	Me	H	B	1	H	H	CF,	CH2C≡CH	O№e
	Me	H	H	1	H	н	ОМе	СН₂С≡СН	CF ₅
Иe	Me	H	H	1	Ħ	H	CF,	CIL _t C≡CH	ORt
Мe	Me	Ħ	સ	1	ĸ	R	O Et	CH ₂ C≡CH	CF.
νie	Me	H	н	l	Н	Н	CF,	CH;C=CH	OCHP ₂
Иe	Me	Н	H	ļı	Н	H	OCHE	CH ₂ C≡ CH	CF ₅
Иe	Me	H	н	1	н	H	Cr,	CH ₂ C=CH	CN
de	Me	Н	Ð	1	н	Н	CN	CH, C= CH	CF ₃
de	Me	Н	H	1	н	н	CF.	CH,C≡CH	Me
Иe	Me	н	н	1	H	н	Me	CH,C≡CH	CF ₂
иe	Me	H	н	1	H	н	CF ₃	CHMeC = CH	Cì
16	Me	H	H	3	н	Н		CHMeC=CH	Cr,
Ac.	Me	н	н	1	H	H	CF:	CH₂C≡ CMe	ci
le.	Me	н	H	1	H	H	C)	CH₂C≡ CMe	CF,
1 e	Me	H	Ħ	1	Ħ	H	cı ·	CHF2	ci
1e	Me	H	Ħ	1	H	н	OCHF2	CHF ₂	la
14	91e	H	A	1	н	н	c)	CHF ₂	OCHF,
10	Me	H	A	1	H	H	OCHF ₂	CHF2	OCHF ₂
16	Me	H	H	1	H	H	CF,	CHF2	cı
16	Me	H	H	2	н	e	C)	CHF.	CP,
ie.	Me	R	H	ī	н	H	CF,	CHF,	F
10	Me	H	H	ı	Н	H	F	Chr.	CF,
1e 1	Me	H	H	1	н	H	cf,	CHF ₂	OMe
14	Me	A	H	ı	н	Ħ	O <u>M</u> e	CHF ₂	CP ₃
<u>(</u>	Mo	H	H	ı	H	H		CHF,	OE:
ie i	Me	ਜ	н	ı	H			CHF,	CF _a
(6)	Me	н	н	ı	Н	ß	CF,	CFIL*	OCHF ₂
(e)	Me	и	H	1	R	н		CHF ₂	CF.
<u>ا</u> چ!	Me	R	Ħ	ı	н		CF.	CHF.	CN
fe]	Me	H	H	1	н	H	CN	CHF.	CF ₂
ie i	Vie	H	H	1	н		CF ₃	CHF,	Me
e i	Me	H	н	1	H	- 1		CHFt	CF,
le l	Me	H	Н	1	н	- 1	Me	CHF.	CI
راء	Me	н	н	1	н		Cı	CHF.	Me

[0079]

【表38】

(48)

93

特闘2002-308857

P,		\mathbb{R}^2	R3	R*	n	R⁵	R	R ²⁹	R ⁹⁰	R ³⁰
	Me		H	H	1	H	H	Et	CHF ₂	CI
	Me		Н	H	ı	H	н	Cı	CHF2	Bt
Me	Me		Н	H	1	Н	H	CF ₃	СН2СНР2	cı
Me	Me		H	Н	1	ਸ	Ħ	Cı	CH ₂ CHF ₂	CF4
Me	Me		Ħ	Ħ	1	H	Ħ	CF ₅	CH2CF:	a
Me	Me	. 4	13	Ħ	1	H	Ħ	C1	CH2CF3	CF ₂
Me	Me		H	Ħ	1	Ħ	H	CF,	сн,он	CI
Ma	Mo		И	8	1	H	Ħ	C1	сн⁵он	CF,
Me	Ma		Ħ	태	1	H	Ħ	C1	СН₂ОМв	Cl
	ΝŒ		H	H	1	Ħ	Ħ	OCHF2	CH₂OMe	cı ·
	Me		H	H	1	H	H	Cl	СНуОМе	OCHF2
1 !	Me	1	H	H	[1]	H	H	OCHF ₂	CH ₂ OMe	OCHF ₂
	Me	1	H	Н	1	H	H	CF,	CH _p OM ₀	P
1 1	Me		H	H	1	н	H	F	CH,OMe	CF ₃
1	Ma		H	Н	1	H	H	CF,	CH ₂ OMe	C1
	Me		H	H	1	H	H	CI	CH ₄ OMe	CF ₃
1	Me		Ħ	EI :	l.	H	H	CP ₃	CH ₂ OMe	ОМе
	Me		H	H	1	H	Н	OMe	CH ₂ OMe	CF ₃
	Me		Н	H	ż	H	H	CP,	CH ₂ OM ₆	OEt
	No		н	H	1	H	H	OCL	CH ₂ OMe	Cr,
	Me		н	H	3	н	Н	CF ₅	CH ₂ OMe	OCHF ₂
1	Me	- 1	Н	H	1	H	Ħ	OCKF2	CH₃OMe	CF.
Me		- 1	H	Ħ	1	H	Н	CF,	CH2OMe	CN
Me			Н	Н	3	H	Н	CN	CH2OMe	CF ₃
Me			Н	H	1	Я	H	CP ₃	CH ₂ OMe	Me
Me			Н	Н	1	Ħ		Me	CH ₂ OMe	CF.
Me			Н	H	1	Ħ		CF3	CH _z OB _t	Cı
Me		ł	H	Ы	1	ы	н	C)	CH _r OEt	CF ₉
Me			H	Ħ	1	П	F}	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OH	a
Мe			Ħ	ਰ	1	н	Ħ	CI	CH2CH2OH	CF _a
Me		1	Ħ	Ħ	1	H	Fi	CF.	CH ₂ CH ₂ OM ₉	CI
Me			H	H	1	H	ß	a	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃
Me		ı	Hi	H	1	H	1	CF,	CH ₂ CH ₂ OBt	CI
Me		- 1	H	14	1	H		CI .	CH ₂ CH ₂ OBt	CF _s
Мe			되	H	1	H	- 1	CF,	CH ₂ NHM ₀	CI
Me			H	н	4	H		CI	CH ₂ NHMe	CF2
Мя			H	H	1	H	- 1	CF,	CH ₂ N(Me),	CI
Me			H	H	1	Ħ		ପ	CH ₂ N(Me) ₁	CF ₃
Me			H	Н	1	н		CF ₃	CH ₂ N(Me)C(=O)Me	CI
Me	Me		H	H	ı	Н	H	CI	C!I ₂ N(Me)C(=0)Me	CF.

[0080]

【表39】

(49)

95

特闘2002-308857

96

R1	R²	E.B	R4	n	Ľ,	R	R ²⁹	R ²⁸	R ^{ED}
Me	Me	R	Н	1	н	Н	CP ₁	CH,N(Me)C(=0)CF3	CI CI
Me	Me	Н	Н	1	H	H	Cl	CH2N(Me)C(=O)CF ₃	CF,
Me	Мe	H	H	3	H	X	CF.	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	C1
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	CL	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF,
Me	Me	H	н	1	H	H	CF ₁	CH,N(Me)SO,CHF,	cı
Me	Me	Н	H	1	H	н	CI	CH_N(M_)SO_CHF_	CP _x
Me	Me	Н	H	2	H	н	CF3	CH ₂ N(Ma)BO ₂ CF ₂	cı
Me	Me	H	H	þ	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)SO ₂ CF ₂	CF ₁
Ma	Mo	H	H	1	H	Ħ	CF ₃	CH,SMe	CI
Mo	Mo	н	H	1	H	H	Cl	СН ₂ SMe	CF,
Me	Me	H	B	1	Ħ	ĒΧ	CF ₃	CH ₂ SO₂Me	CI
Me	Me	H	Ħ	1	H	Ħ	C)	CFI ₂ SO ₂ Me	CF ₁
Me	die	И	H	1	Н	H	CF,	CH ₂ CH ₂ SMe	ત
Me	Me	H	Ð	1	H	Ħ	CI	CH₂CH₂SMe	CF ₃
Me	Me	H	H	1	н	H	CF,	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CI
1 1	Me	Н	H	1	H	н	C1	CH _t CH _t SO ₂ Me	CF _e
	Me	H	И	1	Ħ	H	CF,	CH₂CN	CI
	Me	H	H	1	H	H	Ci	CH3CN	CF ₂
1	Me	H	н	1	н	Н	CF,	CH ₂ C(=0) OM e	CI.
	Me	H	H	1]	H	Н	C1	CH ₁ C(=0)OMe	CP ₃
	Me	Н	[·]	1	H	H	CF,	CH ₂ C(=0)OEt	CI
1 1	Me	H	Н	1	H	H	CI	CH ₃ C(=O)OEt	CP ₂
1 1	Me	н		1	Н	H	CF,	CH(Me)C(=O)OMe	cı .
1 1	Me	Н	Н	1	H	H	CI	CH(Me)C(=O)ONe	CF ₃
1 1	Me	н	н	1	H	Н	CF,	C(Mc)2C(=0)OMe	Cl
Me		H	H	1	H	H	CI	C(Me) _g C(=O)OMe	CF ₃
1 1	Me	H	H	1	Н	H	CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	C1
1 1	Me	14	Н	1	H	М	CI	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₂
Me		Н	H	1	H	H	CF ₂	CH ₂ C(=O)NHMe	C1
	Me	14	H	1	н	н	Cl	CH ₂ C(=0)NHM ₀	CF,
	Me	н	H	1	77	H	CF,	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CI
Me		H	H	1	H	H	CI	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	CF,
Me		H	H	3	и		CF ₃	=	CI
Me		H	H	1	H	H	CI		CF _t
Me		H	H	1	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=NOM ₀)M ₀	CI
Me		Н	H	1	H	H	Ç1	CH ₂ C(=NOM _e)M _e	CF,
Me	,	H	H	1	H	ы	CF,	-	CI .
Me		H	H	1	н	H	CI CD		CP _u
Me		ਜ ਹ	H	1	H	H	CF.	CH ₂ CH ₂ C(=0)Me	CI
Мо	L/18	H	H	L	Н	Н	CI	CH ₂ CH ₂ O(=0)Me	CF ₃

[0081]

【表40】

(49)

特関2002-308857

R⁸ R⁴ n R⁵ R⁶ Me Me H н CH,N(Me)C(=0)CF3 ឡ Me Me н CI H H H CH2N(Me)C(=O)CF₃ CP, CF. Me Me H H Н ĸ CH,N(Me)SO₂Me Cl Me Me CH₂N(Me)SO₂Me Ħ H H H CI CF, MeMe H н H CF. H CH_N(Me)SO_CHF_ CI Me Me H H Н H Ct CH,N(Ma)SO,CHF. CF, Me Me H H ĸ H CF3 CH,N(Ma)BO,CF, CI MelMe H H H H Cl CH, N(Me)SO, CF, CF, Mali H H H H CF. CH,SMe CI Mo Mo H H H H Cı CH₂SMe CF, Me Me H H Ħ H CF. CH₂SO₂Me CI MeMe H H Ħ H C) CFI-SO, Me CF, Me Me H H H CF, Cil₂Cil₂8Me cı Me Me H H CI H H CH₂CH₂SMe CF, Me Me H H CF, Н H CH2CH2SO2Me Cl Me H H H H CI CF. CH,CH,SO,Me Me H Н H H CF. CH₂CN Ci Me H H CI CH,CN Mig H H CF, Me Me H н H H CF. CH₂C(=0)OMe C1 H C1 H Me Me H н CH₂C(=O)OMe OF₅ Me Me н H H CF. CH₂C(=O)OEt Cl Ne Me Н Н H H CI CH,C(=O)OEt CP, Ma Me Н H 1 Н H CF. CH(Me)C(=0)OMe (CI Me Н Н н си CH(Me)C(=O)OMe CF, Me Me H H Н H CF, C(Me)_aC(=O)OMe Cl H H H CI Me Me Н CF3 C(Me)_fC(=O)OMe Me Me H Н Н H CF3 CH2C(=O)NH2 CI Н H H H CI Me Me CH₂C(•O)NH₂ CF: H 1 1 Me Me H H CF. CH_zC(=O)NHMe CI H H H CI Мe Н CF, CH₂C(=O)NHMe Н H CF. Me H 1 H CH2C(=0)N(Me)2 C H Me H H H CI CH2C(=O)N(Me)2 CF, **11e** H Ħ H H CF3 CH₂C(=0)Me a Μe H Ħ H CI H CH_gC(=0)Me CP, Ħ Me Ħ H CF, H CH2C(=NOMo)Me Me H H e Ci н CH2C(=NOMe)Me CP, Me H H CF. H CH2C(=O)CFa a Me Ħ 17 1 И H C CH₂C(=O)CF₆ CF, HIL H CF. MeMe Ħ H CH₂CH₂C(=O)Me CI

[0081]

Н

Н

н ст

【表40】

CH₂CH₂C(=0)Me

(50)

特闘2002-308857

4	n	c	٠
	-	и	

				"						98
R ¹	E2		т	R ¹		-	Re	R ₅₀	克 ²⁰	R ^{€0}
Me	Ma	H		ы	3	H	H	Me	Ph	Me
Me		н		H	1	H	1	Me	Ph	C3
Me		H	1	н	1	H	н	Et	Ph	C1
Me		н		H	1	H	Н	P.	Ph	C1
Me	Me	Н	١	Я	1	H	H	Pr-i	Ph	cı
Me		Н	1	H	3	H	H	Bu-t	Ph	C)
Me		Н	1	H	2	H	H	CH ³ ONe	Ph	cı
Me		н	1	H	1	H	H	Cl	Ph	C1
Me		H		Н	1	H	H	OCHF ₂	Ph	C1
Mo		Я		H	Į,	H	H	OCHF ₂	Ph	OCHP:
Me		Я	1	Ħ	1	H	Ħ	CHF ₃	Ph	CI
Me	Me	Н	۱	H	1	H	H	CF ₂	Ph	H
M 2		Н	- 1	н	1	H	H	CF2	Ph	Me
Ма	Me	H	1	H	1	H	H	Me	Ph	CP ₁
Me	Me	H	1	H	λ	Ħ	H	CF,	Ph	Et
Me	Me	H	1	н	1	H	н	CF,	Ph	Pz-i
M	Me	Я	ı	н	1	н	Н	CF,	Ph	CHF ₂
Me	Me	Н	ı	Н	1	H	H	CF;	Ph	CF _s
Me	Me	Н	1	e	ı	H	H	CF _R	Ph	F
Me	Me	н	ı	н	1	H	Ħ	CF ₄	Ph	C1
Me	Me	н	1	н	1	н	Н	Ċi	Ph	CF ₂
Me	Me	H	1	H	1	н	H	CF,	Ph	он
Ме	Me	H	l	H	1	H	H	OH	Ph	CF.
Me	Me	Н	ı	ы	1	H	H	CF.	Ph	OMe
Me	Me	н	ı	ы	1	н	Н	OMe .	Ph	CF ₂
Me	Me	H	ı	H	2	н	Н	CF.	Pb	OEŁ
Ме	Me	н		н	1	H	Н	O Et	Ph	CP,
Me	Me	H	ı	н	1	H	Н	CP ₃	РЬ	OP~I
Me	Me	H	I	н	1	H	H	CF ₃	РЬ	OPr
Me	Me	H	ı	ы	1	H	Ħ	CF ₃	Ph	OBurt
Me	Me	H	1	ы	1	ы	11	CF ₂	P h	OCH₂Pr∙c
Me	Me	Ħ	1	Ħ	1	н	Ħ	CF ₃	Ph	och,ch≂ch,
λje	Me	H		Ħ	ı	H	Ei	CF ₃	Ph	OCH C≡CH
3/16		<u>+1</u>	ı	H	1	H	A	CF,	РЬ	OCHF ₂
Мe	Me	H	1	버	ì	H	B	ochr ₂	Ph	CP ₃
Мо	Me	H		띮	Ł	H	e	CF,	Pb	OCEI2CHTs
Me		Ð		Ħ	1	H	B	CF,	Pb	och₂cp₃
Me		H	1	H	1	H	H	CF,	Ph	ОСН ₄ С(=0)ОМь
Me		H	ľ	Ħ	1	н	H	CF3	Ph	OCH(Me)C(=0)OMe
Ме	Me	Н		H	넵	H	H	CF,	Ph	OC(Me) ₂ C(=0)OMo

[0082]

【表41】

(51)

99

特闘2002-308857

100

R)	R²	R ⁸	R'	n	\mathbb{R}^{δ}	Re	RTP	R ²⁸	R ³⁰
_	Me	ਸ	Ħ	2	H	H	CF.	Ph	OC(=O)Me
	Me	н	Н	1	Ħ	н	CF _a	Ph	OC(=O)Et
Me	Me	н	Н	i	H	H	CF,	Ph	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	CF ₃	Ph	OC(=O)CF ₃
Me	Me	Ħ	Ħ	1	H	Ħ	CF ₈	Ph	OC(=O)Ph
Me	Ms	н	H	1	H	н	CP ₉	Ph	OSO ₂ Me
Me	Mo	н	Ħ	1	Ħ	H	CP,	Ph	OSO ₂ Et
240	Me	Ħ	Ħ	1	H	н	CF ₂	Ph	OSO ⁵ CH ³ bP
Mc	Me	H	Н	1	Н	Н	CF,	Ph	OSO ₂ CF ₂
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	CF ₂	Ph	OSO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	CF.	Ph	SMe
Мe	Mée	H	H	ı	Н	H	CF,	Ph	80 ₂ Me
	₿₫e	H	H	1	H	H	CP,	Ph	SEc
Ma	Me	Ħ	H	1	H	H	CF _{\$}	Ph	SO₃Et
Me	Me	Ħ	표	Ŧ	Ħ	Ħ	CF ₂	Ph	SPr-i
Me	Me	H	H	1	H	H	CF3	Pե	SO ₂ Pr-i
Me	Me	H	Ħ	1	ন	न	CF ₀	Ph	SPr
Me	Me	H	Ħ	I	Ħ	ਸ਼	CF ₃	Ph	SO₂Pr
Me	Me	H	H	1	Н	н	CF8	Ph	\$Bu-t
Me	Me	Ħ	ਜ਼	1	Ħ	Ħ	CF ₈	Pb	SO ₂ Bu-t
Mc	Me	H	Ħ	1	Ħ	Ħ	CIP ₈	Pb	SCHF ₂
Me	Me	H	Ħ	1	Ħ	Ħ	CF₃	Ръ	SO ₂ CHF ₂
Μu	Me	Ħ	Ħ	1	H	Ħ	CF ₃	Ръ	NH ₂
Mc	Me	H	អ	1	Ħ	Ħ	CF ₈	Pb	NFIMe
Mc	Me j	H	H	1	Ħ	Ħ	CF8	Рb	N(Me),
Ma	Me	H	H	1	H	H	C₽ ₂	Pb	NHC(=0)Me
396	Me	H	H	1	H	H	CF ₅	Pb	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	1	H		CF ₈	Ph	NIISO _s Me
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	CF ₃	Ph	N(Me)8O ₈ Me
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	CF ₃	Ph	NHSO ₂ CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₅	Ph	N(M ₀)SO ₂ CF ₈
Me	Me	Ħ	u	3	H	H	CF,	Ph	NHPh
	Me	Ħ	H	3	H	H	CF _a	Ph	N(Mo)Ph
	91e	Ħ	Ħ	1	н	H	CF ₃	Ph	CIN
	Me	H	H	1	H	H	CF ₂	Ph	C(=O)Me
	Mo	H	H	1	H	H	CF ₃	Ph	C(=0)0Me
1	Me	H	H	ı	H	H	CP ₈	Ph	C(=O)NH ₂
	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	C(=O)NHMe
	Mo	H	H	1	H	H	CF ₈	Ph	C(=O)N(Me) ₂
Me	Me	H	H	1	ਸ	Ħ	CF ₈	Fh	Imidazol-1-yl

[0083]

【表42】

(52)

101

特闘2002-308857

102

R'	R ²	R ⁸	B,	n	\mathbf{R}^{L}	R ⁶	R26	R ²⁶	R ⁵³
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	CF ₅	Ph	Pyrazol-1-yl
Me	Me	Ħ	IJ	1	н	A	CF,	PA	1,2,4-Triazol-1-yl
Me	Me	H	Ħ	1	Ħ	H	CF,	Ph	1.2.4-Triasol-4-yl
Me	Me	Ħ	Ħ	1	11	Ħ	CF,	Ph	Tetrasol-l-yi
Mac	Me	H	н	1	Ħ	H	CF ₂	Ph	Tetrapol-ö-yl
Me	Mo	H	H	1	H	H	CF _a	Ph	(4,6-
1									Dimethoxypyrimidin-2- vlioxy
Me	Me	H	н	ı	H	H	CF,	Ph	(4,6-
									Dimethoxypyrimidin-2-
M4.	Me	H	Ħ	ı	H	H	CF,CF,	Ph	yl)sulfonyl Cl
	Me	H	н	1	H	H	CF ₂ CF ₃	(2-CL)Ph	CI.
-	Me	н	H	ו	H	H	CF,	(2-F)Ph	Cl Cl
	Mo	H 11	H	1	Н	H	CF,	(2-OMe)Ph	ci.
	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	(2-Me)Pb	CI
	Me	Н	Н	1	н	н	CIF ₂		CI CI
	Mo	H	Н	1	H	н	•	(2·NO ₂)Ph	CI CI
1	Me	H	H	1	H	Н	CIP _S	(2-CN)Ph	CI CI
	Me	n H	ਜ ਜ	1	ਸ ਸ	л Ħ	CP ₂	(2-C(=0)&6)Pb	CI CI
1	Me	н	H	1	Н	Н	CF _a	(2-C(=0)OMe)Ph	a
	Me	Н	Н	1	н	П		(2-C(=0)OBi)Ph	ci
	Me	Н	н	1	H	H	CF ₃	(2-C(=0)OPr-i)Ph (2-C(=0)NH ₂)Ph	ci Ci
	Me	н	H	1	Ħ	H	CF ₃	(2-C(=0)NHMe)Ph	a
	Me	H	H	1	H	H	CF ₄	(2-C(=0)NMe ₂)Pb	o a
1	Me	H	H	1	н	H	CF ₃	(8-CI)Ph	a a
	Me	Ħ	H	1	н	H	CF ₂	(8-I')Ph	G G
•	Me	H	Н	1	Н	H	CF _s	(8-OMe)Ph	S CI
	Me	H	Н	2	H	H	CF _S	(3-Me)Ph	G CI
	Me	Н	н	į	H	H	CF ₃	(8-NO ₂)Ph	a
	Me	H	H	1	H	H	CF ₈	(3-CN)Ph	3 C
	Me	H	H	1	н	Н	CF.	(3-C(=0)Me)Ph	a
1	Me	H	Н	1	H	ы	CF ₂	(3-C(=0)OMa)Pb	CI
[Me	H	H	1	Н	Н	CP ₃	(S-C(=O)OE()Ph	CI
1	Me	H	H	1	н	H	CF,	(3-C(=0)OPr-i)Ph	CI.
	Me	H	H	1	н	н	CF _a	(3-C(=0)NH _a)Ph	CI
	Me	н	Н	1	Н	Н	CF ₃	(3-C(=0)NHMa)Ph	CI
	Me	н	Н	1	н	H	CF.	(3-C(=0)NMe ₂)Ph	CI CI
	Me	H	н	1	H	H	CF,	(4-CDPh	G.
	Мо	н	н	1	н	H	CP ₂	(4-F)Ph	Ci.
				ιı	_				
Me	Mo	H	H	ı	Ħ	Ħ	CP8	(4-OMe)Ph	Cl

[0084]

40 【表43】

(53)

103

特闘2002-308857

R2	R1	R³	R*	מ	RS	Rå	R ²⁰	R ²⁸	Rac	
	Me	Ħ	Н	1	표	H	CF3	(4-Me)Ph	Cl	
Me	Ma	Ħ	ĸ	1	Ħ	H	CF,	(4-NO ₂)Ph	Cl	
Мс	Mo	H	H	4	H	H	CP.,	(4-CN)Ph	C1	
Me	Mo	H	н	ı	H	Ħ	CP ₃	(4-C(=0)Me)Ph	cı	
Me	Me	Н	H	1	н	Н	CF3	(4-C(=0)OMe)Ph	C1	
Me	Me	n	н	ı	H	Ħ	CP,	(4-C(=0)OBt)Ph	[Cl	
Мө	Me	Ħ	ĸ	1	H	H	CF ₃	(4-C(=0)OPr-i)Ph	Cl	
Me	Ne	И	ĸ	1	H	H	CF ₃	(4-C(=0)NT(2)Ph	Cl	
Me	Me	H	Ĭi	1	Ĥ	H	CP,	(d-C(=O)Nt(Me)Ph	Cl	
Ma	Me	Ħ	Ħ	1	H	H	CF,	(4-C(=0)NMe ₂)Ph	Cl	
	Me	H	H	1	H	H	CP ₅	Pyrmichn-2-51	CI	
	Me	H	Ħ	기	H	ਜ	CP _s	4.6-Dimethoxypyrmidia-2-yl	C1	
	Me	H	ਜ	3	H	Ħ	CP,	Thiophen-2-yl	CI.	
1	Me	н	H	1	н	ਜ	CP ₃	Furan-2-yl	CI CI	
	Me	H	Н	1	H	Ж	CP,	SO ₃ Me	a	
Me		H	H	1	H	н	CF3	SO _t Et	cı	
Me	Me	H	H	1	H	H	CF ₃	\$O _p Proi	Ci →	
	Me	H	H	1	(1)	14	CF3	so,ck.ph	CI	
Mc	Me	H	Ħ	1	H	34	CP₃	so,chf,	C1 .	
Me		н	H	1	H	H	CP ₃	So.cf.	CI CI	
Me	Me	н	H	•	н	A	CF ₆	SO ₂ Ph	a	
Mo		H	H	1.	H	Ħ	CF,	Ci=OjMe	CI	
Me		H	H	ŧ	Н		CF ₃	C(=O)Et	a	
Me		H	H	A	H	H	CP ₃	C(=O)Pr·i	CI .	
Me		H	Ħ	1	H		CF _B	C(=O)Bu-t	CI CI	
Мө		H	H	1	H		CF,	C(=0)Ph	CI	
Me		И	H	1	Ħ		CF ₈	C(=O)CH ₂ Ph	CI	
Me		Ħ	Ħ	ţ	н	B	CF _B	C(=O)CH3CI	CI	
Me		Ħ	ᅯ	1	н		CF8	C(=0)CHCl ₂	CI	
Μs		H	н	1	H		CF ₂	C(=O)CF ₃	CI	
Μæ		H	И	1	Ħ	Н	CF,	C(=0)OMe	Cl	
Me		Ħ	И	1	н	Ħ	CF,	C(=0)0Ph	CI	
Me		H	Ħ	4	Ħ		CF _s	C(=0)OCH2Ph	CI	
Me		Н	И	니	F	- 1	CF2	C(=0)NHD40	CI CI	
Ma		H	Ħ	1	н		CF,	C(=0)N(Mo);	CI	
Mo		H	Ħ	1	Ħ	1	CF ₃	C(=O)NHPb	CI	
Me		H	Н	4	H	н	CK9	NH ₂	CI	
Ma		H	H	1	H	H	CI	-(CH ₃) ₂ O-		
Me		H	H	2	Ħ		a	·(CH ₂)·O·		
Me	r4s	H	Н	1	H	Н	CI	-(CH ₂) _s (≯	

[0085]

46 【表44】

(54)

105

特闘2002-308857

R1	R	R ³	\mathbb{R}^{d}	n	R ⁶	R	R ²⁹	R ⁹⁸	R ²⁰
Me	Me	H	н	ī	H	н	Cì	-{CH ₂ 1 ₂ 9	O ₈ .
Mo	Me	H	H	ì	H	н	CF:	-(CH ₂) ₂ (3 -
Me	Me	H	H	1	Ħ	н	CF,	-{CH ₂) ₂ (>
Me	Me	H	H	1	H	н	CP,	-(CH ₂) ₅ (Ş -
Mo	Ma	H	H	ı	H	н	CP.	-(CH ₉) ₈ S	02-
Me	Me	H	н	1	я	H	OM c	-(CH ₂).	
Me	Me	н	H	1	В	н	OCHP ₂	-(CH ₂);	•
Ħ	H	Ħ	н	1	H	H	CF,	Me	a
Μє	H	H	Ιť	1	H	Ħ	CF.	Me	Ci
Me	H	Me	H	1	H	H	CF,	Me	a
Mo	Me	Me	H	ï	Ħ	Ħ	CF3	Me	Ci
Me	Me	H	H	1	Me	H	€F₃	М о	a
Me	Me	H	H	1	£t	Ħ	CF2	Me	CI
Me	.VIo	11	11	1	Pr-i	H	CF ₁	Me	(CL
Me	Me	H	H	1	Me	Me	CF ₃	Me	CI
Me	Eat.	H	H	ı	н	Ħ		Me	CI CI
Bt	Bi	H	H	5	н	H	CP,	Me	CI.
Ma	Pr-i	H	Ħ	1	н	H	CF ₃	Me	Ci
Me	Pr	H	H	1	H	H	CF,	Me	ા
Me	Pr-c	Ħ	H	1	H	표	CF1	Me	CI
Me	CH ₂ Pr-c	Ð	Ħ	ŀ	H	H	CF,	Me	ci
<u>Γ</u>	(CH2)	Ħ	H	1	H	H		Me	CI.
	(CH ₂) _p .	H	н	ונ	H	Ħ	CF,	Me	લ
	-(CH ₂)4-	Ħ	Н	1	H	H	CF:	Me	લ
L	(CH ₂) _b .	H	H	2	H	H	CF _z	Mo	CI
Ħ			H)	H	Ħ	CF;	Me	a
H			H	1	H	H	CP,	Mo	a
H			н	1	H	H	CF,	Me	(CL
H	-(CH ₂)	<u>-</u>	H	1	H	Ħ	CF ₂	Me	CI .
	Me	H	H	0	H	H	CI	н	a
1	Me	H	Ħ	0			OCHF;	H 	CI
	Ме	H	Ħ	0			OCHP ₂	Н	OCHP,
	Me	H.	н	G	1 3	H	CHP,	H	CI
	Me	H	H	¢	H	u	CF:	н	F
	Mə	H	H	0		H	CF ₃	н	Ci
	Me	ㅠ	H	٥	1	H	CF ₀	H	ONe
	Me	H	H	0	i 1	H	CK ³	н	OEt
1	Ma	ਜ਼	H	١٥		H	OP₃	H	OCHF ₂
	Me	H	H	0		£1	CP ₃	ዝ 	CN
Me	Ma	H	H	0	Н	H	CF _a	н	Me

[0086]

40 【表45】

(55)

167

特闘2002-308857

108

Rì	R ^a	H ³	R*	n	K [€]	Ré	Rio	R ²⁵	Rise
	Me	H	н	0	н	H		Me	CI
Μe	Мə	H	н	0	Ħ	H	Me	Me	Me
ide	Me	Ħ	13	0	H	H	Me	Mo	a
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	C1	Ma	Me
Me	Me	Ħ	H	O	H	н	E t	Me	a
Me	Mo	H	H	0	H	H	C1	Me	Et.
Me	Me	Ħ	H	8	H	H	Pirt	Me	a
346	Mo	브	H	0	H	Н	C1	Ate	Pz-i
£460	Мэ	H	H	o	H	H	Bu-t	Ma	Ci Ci
Me	Me	ਜ	Ħ	o	H	ਜ	CI .	Mi e	Bu-t
≜ fe	Me	н	н		H	H	Cl	l-le	CI
	Me	H	Н	이	H	H	CHF,	Me	Ci
	Me	H	H	0	H	н	C1	Me	CHF ₂
	Me	H	н	0	U	Ħ	OCFIP,	Me	H
l-le	Me	Н	H	٥	Н	н	OCHF,	Me	CI
	Me	H		0	H		Cl	Ma	OCHF ₈
1 1	Me	H	Ħ	O	H	Ħ	CCHF ₂	Me	OCHP ₁
	Me	H	H	0	Н		€F3	eld	н
	Me	H	H	0	H	H	CF ₄	Me	CI
	Me	Н	H	o	H	Ħ	Cl	Me	C₽ ₃
1	Me	н	н	G	н		CILS	lde	F
1 1	Me	Ħ	H	G	Н		I.	Me	CP,
	Me	H	H	3	H		CF2	Me	ОH
	Me	ří	Н	O	H	H	он	Me	CP _s
	Me	Ħ	H	0	Ħ	H	Ch.3	Me	OMe :
	Me	ří	H	٥			OMe	Me	CF ₈
	Me	Ħ	Ħ	٥	H		cr.	\$1e	0Et
1 1	Me	H	H	0	H		OEi	Me	CF3
	Mo	H	K	0	A	н	CF ₃	Me	OPr-i
	Me	H	H	Đ	R		CF _a	Me	OPr
Me		н	H	0	H		CF ₉	Me	ОВо-к
Me		Н	H	D	B	H	CF ₃	Me	OBu-s
	Me	H	H	۵	E	H	CF ₈	Me	0Bu-a
Me		H	H	9	Œ	H	CF.	Me	OBu
Me Mo	Me Ma	Н	H	0	R	H	CF ₈	Me	O(2-Pan)
		H	H	0	A	H	CF ₃	Me	O(3-Pen)
	Me	H		0	H	H	CF ₈	Me Me	OPen-n
	Me Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Me Me	O(2-Hex)
	Me	н	н	0	H	H	CL*	Me	O(S-Hes)
INTE	unti	n	1.4	<u>'</u>	п	п	CF ₈	NOSE .	ОНех-п

[0087]

40 【表46】

(56)

109

特闘2002-308857

110

R.	Rt	R ³	Ri	n	R ^{\$}	Rª	R ²⁹	R ^{\$0}	(Ç _{so}
Мо	Me	Н	H	0	H	H	CF ₈	Mc	OPen-c
Мн	Me	H	H	이	Ħ	H	CF _a	Me	Olfex c
Me	Me	H	H	ø	H	Ħ	CP,	Me	OCH _g Pz-c
Me	Mo	H	н	١٥	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Burc
Me	Me	H	н	0	H	H	CF,	blo	OCH ₂ Pea-o
Me	Me	н	Ħ	0	H	H	CP,	Me	OCH3Hek-c
Me	Me	н	н	이	Ħ	н	CF ₂	Me	OCH3CH=CH2
Me	M÷	H	H	o	H	Ħ	CF ₈	Me	OCH2C*CH
Me	Mo	H	н	0	Н	ы	CF ₈	Die	OCHF,
Me	Me	H	Ħ	0	H	Ħ	OCHF,	Ma	CF ₃
Me	Мв	H	Ŀ	0	н	li	CP3	Mc	OCH_CH!',
Mo	Mc	H	H	G	H	н	OCH2CHF2	Ma	CF ₃
Me	Mo	H	н	٥	H	Н	CP,	Me	och₂cr₂
Me	Me	H	H	٥	Ħ	Ħ	OCH ₂ CF ₃	Me	CP,
Me	Me	H	н	이	Ħ	ਜ	C₽ ₈	Me	OCH2CN
Me	Me	H	H	이	H	H	CF ₃	M6	OCH2C(≃O)OEL
Me	Me	Ħ	EI	0	Ħ	Ð	CF _B	Me	OCH(Ma)C(=O)OEt
Me	ble	н	H	0	H	H	CP _s	Me	OCH _z C(=0)NH _z
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OCH_O(=O)NHMe
310	Me	H	Ħ	이	н	H	CF _a	Me	OCH ₂ C(=U)N(Ne) ₂
Me	Me	H	H	ø	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Ph
Sie	Me	Ħ	H	0	Ħ	H	CF ₃	Me	OPh .
	Me	Ħ	H	0	H	H	CF,	Me	O(2-CI)Ph
4	Me	Ħ	H	이	H	벍	CF ₈	Me	O(2-Br)Ph
Me	Мө	H	H	미	H	H	CF ₈	Mc	O(2-P)Pb
1	Me	Ħ	14	이	H	H	CF ₈	Me	Q(2-Mc)Ph
	Me	H	H	٩	H	Ð.	CF ₃	Me	O(2-OMe)Ph
	Me	H	H	이	H	H	CF ₃	Me	CX2-NO-)Ph
1	Me	И	Ħ	a	H	H	CF ₅	Me	O(2-CN)Ph
1	Mo	H	H	이	R	H	CP ₃	Me	O(2-C(=O)OMe)Ph
1	Me	И	H	Ω	Ħ	H	CF,	Me	O(9-CI)Ph
1	Ме	H	H	인	H	H	CF;	Me	O(3-Br)Pb
1	Me	H	Н	O	H	H	CF ₃	Me	G(3-P)Ph
1	Me	Н	H	O	H	H	CF.	Me	O(3-Me)Ph
	Me	H	H	0	H	Ħ	CF,	Me	O(3-OMe)Ph
	Me	H	H	0	H	H	CF:	Me	O(#NO ₂)Ph
	Me Me	H	H	0	н	H	CF _{\$}	Me Me	O(3-CN)Fb
	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	Me	O(3-C(=O)OMe)Ph O(4-Cl)Ph
3		H	H	1 1	Н	Н	1 -	Me	O(4-Ci)Ph O(4-Br)Ph
ALC	Me	172	L	Ü	п	12	CF,	Ircs	CI(4-DE)LB

[8800]

40 【表47】

(57)

111

特闘2002-308857

R'	R*	R ³	R4	n	R*	ΙÇ	R ²⁰	R ³⁶	Rin
Ma	Me	H	Н	0	H	H	CF,	ble	O(4-F)PL
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	CF,	Me	O(4-Me)Ph
Me	Me	Н	н	0	H	H	CF ₂	Me	O(4-OMe)Ph
Mo	Мо	Ħ	н	0	Н	H	CF ₂	Me	O(4-NO ₂)Pb
Me	ملاة	H	14	0	Н	H	CF ₈	Mo	O(4-CN)Ph
Me	Mé	Ħ	H	0	Ħ	H	CF.	Me	O(4-C(=O)OMe)Ph
Me	Me	H	н	0	н	Ħ	CF ₃	Me	OC(=0)Me
Mo	Me	H	£ſ	0	н	н	CF ₅	i Te	OC(=0)Bt
Me	Me	Ħ	H	0	В	Ħ	CF.	t/a	OC(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	ß	H	H	CF ₃	Me	OC(=0)OP ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Me	OC(=0)Ph
Mo	Me	Н	н	0	н	H	CF ₅	Ma	OSOM
Me	Me	H	н	û	H	Н	CP3	Me	OSO _i Rt
Mc	Me	H	H	٥	H	H	CP3	Mo	озо,сн,рь
Me	Mo	લ	н	이	H	H	CF ₅	Me	oso,cf,
Ma	Me	H	H	0	Ħ	H	CF,	Me	OSO₃Ph
A Se	Me	н	H	0	H	H	CP ₃	Me	IMe:
Ms	Me	Н	Н	0	H	H	CP ₅	Me	SO ₃ Me
M⊵	Me	H	н	0	Ħ	H	CP _a	Me	SEt
Me	Me	H	H	0	H	H	CP ₉	Me	SO ₅ Bt
Мe	Me	Ħ	ĸ	٥	Ð	11	CP ₂	Me	SPr
Мо	Me	H	Н	6	H	H	CF ₃	Me	SO ₅ Pr
Me	Me	H	H	٥	H		CF ₈	Me	SPx-i
Me	Me	Н	H	0	H	A	CF8	Me	5O ₂ P±-i
Me	Me	H	H	0	H	H	CP3	Me	SBu-t
Me	Me	H	H	0	H	П	CF ₈	Me	SO _t Bu-t
Me	Me	H	H	0	Ħ			Me	SCHF ₂
Me	Me	H	Ħ	O	Ħ		CP ₈	Me	SO ₂ CHP ₂
Mə	Me	н	Ħ	0	H	H	CF ₈	Me	SCF ₃
1	Me	H	H	0	Ħ	H	CP.	Me	SO ₂ CF ₂
	Me	ű	H	e	łí	,	CF ₃	Me	STb
	Me	H	H	0	н		CF ₅	Ma	SO ₂ Pla
1	Ma	H	Ħ	0	H	A	CF _B	Me	SCH,Pb
1	Me	H	Ħ	이	H	И	CF's	Me	49,EE),OB
1	Me	H	н	0	Ħ	Н	CP,	Me	SCH ₂ C(=0)OEt
Me		ы	놴	0	Ħ	И	op,	Me	30'CH'C(=D)DEr
Me		H	Ħ	0	Ħ	H	æ,	Me	SCH(Me)C(=0)OEt
Me		ĸ	Ħ	0	Ħ	Н	CP ₃	Me	SO_CH(M)C(=0)OE&
Me		ы	ഥ	0	Ħ	Н	CF,	Me	SCH_C(=0)NH2
Me	A 1 e	Ħ	ਜ	Û	H	H	CF₃	Me	SO3CH1C(=O)NH3

[0089]

40 【数48】

(58)

<u>11</u>3

特闘2002-308857

111		

R	R2	R*	ĸ	4 3	RS	Re	R ²⁹	Rit	R ²⁰
Me	M:	H	H	0	H	H	CF.	Ме	SCH,C(=O)NHMs
Me	Me	H	H	ιJo	14	H	CF.	Me	SO ₂ (TH ₂ C(=O)NHM ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF.	Me	SCH,C(=0)N(Mo),
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₂	Мв	SO2CH2C(=O)N(Mo)2
Me	Ma	H	Н	0	H	H	CF ₃	Me	NH.
Me	Mə	H	H	0	Ħ	H	CF.	Me	NHMe
Me	Ma	Ħ	H	0	Ħ	Ħ	CF ₄	Ме	N(Me)
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	Ma	NHC(=0)Me
Me	Me	н	H	0	H	Ħ	CF _a	eM	N(No)C(=0)Me
1	Me	H	H	G	Н	н	CF ₂	Mc	NH90 ₂ Me
	Me	H	H	0	H	Н	CP _t	Me	N(Mo)SO,Me
1	Me	H	H	U	н	H	CP ₃	Me	NHSO,CHF,
1	Me	H	Ħ	0	H	н	CP ₂	Me	N(Me)SO ₂ CHF ₂
	Me	H	Ħ	0	H	Ħ	CP ₃	Me	M-(90,CP)
Me		H	н	0	H	H	Ç₽ ₃	Me	N(Me)SOZCE
1 1	Me	H	H	0	H	Ħ	C₽ _s	Me	NHIPb
Me		H	H	Ü	H	H	CF.	Me	N(Me)Ph
Me		H	H	0	H	И	CF ₃	Mo	CN
Me		ਮ	H	0	H	а	CN	Me	CF ₅
Me		н	H	0	H		CF ₂	Me	C(=O)OMe
Me		H	H	이	A		CP ₈	Мa	C(=O)OCH2Ph
Ma		K	H	٥	Ħ		CF ₈	Me	C(=C)OPh
Me		H	H	G	H			l4e	C(=O)NH _Q
Me		H	Н	0	H			1	C(=0)NHMe
Me		H	H	0	Ħ	- 1			C(=O)N(Me);
Me		a	ři.	0	H	- 1	- 1		C(=O)Me
Me		ß	14	0	H	1		9	C(=0)CF ₂
Мe		Ħ	H	9	Ħ		· I		C(=0)CH ₂ PL
Me	3	н	Н	Ū	Н		• ,		C(=0)Ph
Me		H	Н	0	H		•		Me
Me .		H	H		H				CF _a
Me I		H	H	٩	H				Et
Me			H		H		•		Pr-1
Me		H	H	9	EI II		- 1		Pr
Me I		H	H	0	H			•	CH ₂ OMe
Me		H			n		"		CF.
Me I		H		0	H	- 1			CHF ₂
Mel		H	- 1	0	n	1	· [1	Ph
Me I		H	- 1	- 1	1	- 1			Cl
urse 1	410	=	14	이	H	<u>H I</u>	Ph [1	Vie 1	Me

[0090]

49 【表49】

(59)

特闘2002-308857

			115	;				(33)	116
R	R ^s	R3	R*	ы	\mathbb{R}^{5}	R ⁶	Ras	R ²⁸	R ₈₀
Me	Me	Н	н	0	Ħ	Ħ	Ph.	bie	CI
Me	Me	н	H	0	Ħ	H	Ph	Me	OEŁ
Me	Me	н	Ħ	0	Ħ	H	Ph	Me	CF,
Me	Me	H	н	ø	Н	Ħ	Ph	Me	Ph
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	CI	Et	CI
	Me	H	H	0	H	Ħ	ochr,	Et	Cl
1	Me	H	H	0	Ħ		CI	Et	OCHF _a
	Me	H	Ħ	P	H		ochp,	Et	OCHE.
	Me	H	H	이	H	Н	CF ₃	Et	F
	Me	И	Ħ	이	H	H	F	Et	cf.
	Me	Ħ	H	0	Ħ	Ħ	CF,	Et	C1
	Me	H	н	0	H	H	Cl	Et	CF ₂
	Me	H	H	Θ	H	H	CF ₃	Et	OMe
	Me	H	H	0	ĸ	H	OMe	Et	CF.
	Me	H	H	0	H	Ħ	•	Et	OEt
	Me	H	Я	0	Ħ	Ħ	OBt	Et .	CF ₁
1 1	Me	н	н	0	H		CF,	Et	OCHF2
	Me	H	A	0	Ħ		OCHF ₂	Et	CF _a
	Me	н	н	0	H	Ħ	CF ₃	Et	CN
	Me	H	H	0	H	H	CN	Et	CF ₃
1 1	Me	Н	Ħ	0	H	H	CF ₉	Et	Me
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	Me	Et	CF₄
1	Me	H	Ħ	o			Cl	Pri	CI
1	Me	H	R	0	H	1	OCHF2	Pr-i	CI
	Me	H	H	0	H		CI	Pri	OCHF4
	Me	H	H	9	H		OCHP,	Pri	OCHF,
1 1	Me	H	H	ø	H		_		r'
	Me	H	H	0	H		F	Pr-i	CF,
1 1	Ms	H	H	0	H			Pr-i	CI
Me		H	H	0	H			Pr-i	CF ₃
1 1	Me	H	H	0	H	1	-	Pr-1	OM•
Me		H	H	0	H			Pr-1	CP ₈
	Me	H	Н	٥	H			Pr-i	OEt
Me		H	Н	0	H			Pr-i	CF ₃
	Me	H	H	0	H			Pr-1	OCHF ₂
	Me	H	H	9	H		_	Pr-i	CF ₃
1 1	Me	H	브	0	H		CF ₈	Pr-i	CN
1 1	Me	H	H	0	H	H	CN	Pr-i	CF,
1 1	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr-i	Me
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	Me	Pr-i	CP ₃

[0091]

【表50】

(60)

<u>11</u>7

特闘2002-308857

118

R.	R ²	RB	R⁴	п	\mathbb{R}^{6}	Re	Rre		R ⁹⁹
Me	Me	Н	н		H	H	CI	Pr	CI
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	OCHF ₂	Pr	CI.
Me	Me	Н	H	0	H	H	a	Pr	OCHP ₂
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	ochr,	Pr	OCHP ₂
Mo	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	Pr	F
1	Me	н	H	0	H	H	f	Pt	CF,
	Me	H	n.	0	Ħ	Ħ	CF.	Pr	CL
	Me	н	H	0	H	H	a	Pr	CF ₉
Me	Me	H	Н	이	H	H	CF,	Pr	OMe
	Me	H	H	1 1	H		OMe	Pt	CF,
	Me	H	H	이	H		CF.	Pr	OEt
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	OEt	Pr	CF ₃
	Мо	H	H	0	H	Ħ	CF ₂	Pr	OCHF ₂
Mo	Me	H	B	0	Ħ	Ħ	OCHT,	Pr	CF,
ò.Ie	Me	Ħ	म	0	H	Ħ	CF ₃	Pr	CN
Me	Me	Ħ	Ħ	0	Ħ	Ħ	CN	Pr	CF _s
Me	Me	H	H	0	H	H	CP ₈	Pr	Mic
Me	Me	Ħ	H	0	Ħ	H	Me	Pr	CF ₃
Me	Me	H	Ħ	0	H	н	CI	Bu-t	a
1	Me	Ħ	Ħ	1	ਸ		OCHF ₂	Bust	a
	Mo	H	Ħ	0	H		ochp,	Bu-t	ochf.
1	Me	H		1	H	H	CF3	Bu-t	H
	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Burt	F
	Me	H	H	이	H	H	CF ₈	Bu-t	a
Me	Me	H	H	ı	H	H	Cl	Bo-t	CP ₆
	Ma	H	H		H	H	CF _s	Bu-t	OMe
	Ma	Ħ	H		H		OMe	Bu-t	Cit ₃
	Me	H	H	0	H		CF ₂	Ba-t	OBt
1	Me	н		٥	H		OEt	Ba-t	CP ₈
1	Me	B		0	H		CP,	Bu-t	OCHF ₂
	Me	H		٥	H		CP ₉	Bu-s	CN
	Me	H	Н		H		CF,	Bu-t	Mo
	Bale	H	H	0	H		Me	Bu-t	CF,
1 1	Me	H		0	Ħ			Ви-в	CI
	Me	H	H	0	H	H	α	Bu-s	CF ₂
	Me	H	н	0	H	H	CP ₈	Bu-i	CI
	Me	H		0	Ħ	Ħ	a	Bu-i	CF,
1 1	Me	Ħ	H		H		CP ₃	Bu	CI
	Mo	H	Ħ	이	H		CI	Bu	CF ₃
Me	Mo	B	표	0	H	A	CF ₉	1-Methylbutyi	Cl

[0092]

【表51】

(61)

119

特闘2002-308857

120

\mathbb{R}^{1}	R ²	R3	R ^t	n	R ⁵	\mathbb{R}^6	Rw	R ²⁸	R ⁹⁰
	Ade	H	H	ō	H	H	Cl	1-Methylbutel	OF ₈
	Me	Ħ	H	o	н	Ħ	CF.	1-Ethylpropyl	CI.
Me	Me	н	Н	0	н	Ħ	Ci	1-Ethylpropyl	CF _s
	î/ i e	п	u	0	H	Ħ	CF _a	1-Pentyl	CI
	Me	Ħ	H	o	H	Ħ	Ca Ca	1-Pentyl	CIF.
	Me	Ħ	H		H	н	CF,	1-Mathylpantyl	CI
	Me	Ħ	H	اها	H	H	CI CI	1-Methylpentyl	CF,
1	Me	H	Ħ	o	H	Н	CF,	2-Ethylbutyl	Ci
	Me	н	Ħ	o	H	Н	CI	2-Ethylbutyl	CF.
Me	Me	н	Ħ	0	Ħ	Ħ	CF,	3,3-Dimethylbutyl	ca ca
Me	Me	Ħ	H	o	H	H	a	3.8-Dimethylbulyl	CF ₂
1	Me	H	H	o	H	H	CF.	1-Hexyl	Cl
	Me	H	H		H	丑	Cl	1-Heryl	CF,
Me	Me	H	H		н	H	CF ₄	1-Heptyl	CI
Me	Me	н	н	o	H	Ħ	a	1-Heptyl	CF,
Me	Me	A	H	ol	H	H	CP ₅	1-Octyl	cı
	Me	H	н	o	H	H	CI CI	1-Octyl	CF,
Ble	Me	Ħ	H	0	H	H	CF.	CH ₂ Ph	a
Me	Me	H	H	o	H	Ħ	CI	CH ₂ Ph	CF ₄
Me	Mo	Fi	Ħ	0	H	Н	CF ₈	Pr-c	CI.
Me	Me	H	Н	o	Ħ	н	CF ₃	Pen-c	CI
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	ÇI	Pen-c	CF.
Me	Me	н	H	o	H	H	CF,	Hex-c	CI.
Me	Me	H	H	0	H	H	CI	Нех-с	CF ₈
Me	Me	Ħ	H	O	H	H	Cl	OH ₂ Pr-c	CI
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	OCHA ²	CH₂Pr-c	CI
Me	Me	Ħ	H	Û	H	H	CI	OH₂Pr-e	OCHF2
Bag	Me	H	Ħ	e	H	Н	OCHT2	CH ₂ Pr-c	OCHF ₂
Mo	Me	Ħ	Ħ	0	H	Н	CIF _S	CH ₂ Pr-c	P
Me	Me	H	ਸ	0	Ħ	H	P	CH ₂ Pr-c	CF ₃
1	Me	R	ਜ	0	H	H	CIF ₅	CH _e Pr-o	ට
1	Me	н	H	0	H	H	CI	CH ₂ Pec	cf,
100	Me	H	H	Đ	H	用	CF ₃	CH ₂ Pr-c	CN
	Me	H	H	O	1	B	CF ₃	СН,Рес	ОН
	Me	H	H			H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OMe
	Me	H	H		H	H	OMe	Ctl ₂ Pr-c	CP,
	Me	H	H	1 1	H	н	CF ₈	CH ₃ Pr-c	OEt
	Me	H	H	ויו	H	H	OEt	CH ₂ Pr-c	CIF.
1	D48	И	H	미	Ħ	H	CF9	CH ₂ Pr-c	OPr⊶i
Mie	Me	H	H	Ð	H	H	CF _a	CH ₂ Pr-c	OPr

[0093]

【表52】

(62)

特開2002-308857

								(02)	1300 2 0 0 2
			121	L					122
\mathbb{R}^2	Eg.	R3	R'	п	R^6	\mathbb{R}^6	R ²⁰	R ²³	R*0
Me	Mo	H	н	٥	H	H	CF3	СН₂Рт∙с	OBu-t
Me	Me	H	н	٥	H	H	CF,	CH ₂ Pr-c	ООН₃Рг∙с
Mo	Mo	H	ਜ	G	Ħ	H	CIP ₅	CH ₂ Pr-c	OCH ₂ Bu-c
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	CF ₈	CH ₂ Pr-c	OPen-c
Mo	Mo	H	Ħ	0	H	H	CF ₃	CH ₂ Pr-c	OCHE2
Ma	Me	Ħ	н	ø	Ħ	Ħ	OCHF ₂	CH ₂ Pr-o	CF ₅
Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	CH₃Pr-c	CM
Ma	Me	H	H	ø	H	Ħ	CN	CH₃Pt~c	cf,
Me	Me	H	H	٥	H	H	CF _B	CH ₂ Pr-c	Me
Me	Me	H	Ħ	이	H	H	Me	CH ₂ Pr-c	CIP _B
Me	Me	H	H	0	H	H	CF _B	1-cyclopropylethyl	a
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	1-cyclopropylethyl	CF ₈
Mu	Me	H	H	o	Ħ	H	CF ₉	CH ₂ (2-Methyl-cyclopropyl)	CI
Mo	Mo	H	H	0	H	H	CI	CH ₀ (2-Mathyl-cyclopropyl)	CF ₃
Me	Me	H	H	o	H	H	CF.	CH ₂ (2,2-Dimethyl-cyclopropyl)	CI
dio	Me	H	н	o	H	H	Ct	CH2(2,2-Dimethyl-cyclopropyl)	CF ₅
Mo	Mc	H	Ħ	0	H	H	CF,	CH ₂ (2-Chlore-cyclopropyl)	CI
Me	Me	H	H	이	H	H	CI	CHg(2-Chloro-cyclopropy!)	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₂	CH ₂ (2,2-Dichlaro-cyclopropyl)	Cl
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	CI	CH ₂ (2,2-Dichloro-cyclopropyi)	CF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CP ₃	CH ₂ (2-Fluoro-cyclopropyl)	Cl
Me	Me	H	Н	0	H	H	CI	CH2(2-Fluoro-cyclopropyl)	CF ₃
Me	Me	Н	H	0	H	H	C₽,	CH ₂ (2,2-Difluero-cyclopropyi)	a
Me	Mie	Ħ	H	0	H	H	CI.	CH2(2,2-Difluoro-cyclopropyi)	CF ₃
Мe	Me	H	H	0	H	Ħ	CP,	СН ₂ Ви-с	CI.
Me	Me	H	H	0	H	丑	a	CH ₂ Bn-c	CF ₅
Me	Me	Н	H	ថ	H	Ħ	CP ₀	CH ₂ Pen-c	CI
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	a	CH ₂ Pen-c	CP,
Me	Me	H	H	٥	H	Ħ	CP ₅	CH₃Hex-c	CI
Me	hle	H	н	O	H	Ħ	Cl	CH ₂ Hex-c	CP ₅
Me	Mo	ĸ	H	이	H	Ħ	C₹ ₆	CH2CH2Pr-c	CI
	Me	H	H	0	Ħ	F	OI.	CH ₂ CH ₂ P ₂ -c	CP ₃
Me	Me	H	Ħ	Ö	И	H	CF ₈	CH ₂ CH=CH ₂	CI.
	Me	H	H	٥	H	H	CI	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₈
	Me	Ħ	H	o	H	H	CF ₃	CH ₂ CH=CHCl	CI
1	Me	Ħ	H	P	н	H	Ci	CH²CH=CHCI	CF ₈
	Me	H	H	G	Н	H	CI	CH ₂ C≖CH	CI.
1	Mc	H	H	0	H	Ħ	OCHF,	CH ₂ C≡CH	a
	Me	H	H	0	K	H	CI	CH ₂ C≡CH	OCHF.
14	Me	Ħ	H	0	H	H	OCHF2	CH ₂ C≡CH	OCHF2

[0094]

【表53】

(63)

123

特闘2002-308857

124

RI		R3	R	n	\mathbb{R}^5	\mathbb{R}^{θ}	R39	R**	R ⁸⁰
Me	Me	H	Ħ	٥	Ħ	H	CP,	CH ₂ C≡CH	F
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	F	CH₂C=CH	CF,
Me	Me	Ħ	Ħ	0	Ħ	н	CF,	CH ₂ C=CH	CI
Me	Me	H	Ħ	0	н	H	C1	CH₃C≡CH	CF,
Mo	Me	H	H	Ð	H	H	CF,	CH2C≡CH	Oblic
240	Me	H	H	O	H	H	OM ₂	CH₂C≡CH	CF ₃
Me		H	H			Ħ	CF ₅	CH₁C=CH	OE%
Me	3 1 e	H	Ħ	0	н	H	0Bt	CH₃C=CH	CP ₈
Me	Me	11	33	0	н	H	CF,	CH4C=CH	OCHF ₂
3√1e		H	H	O	H	H	OCHF2	CH ⁴ C≡CH	CP ₈
Me		H	Ħ		H	H	CF ₂	OH2C=CH	CN
Me	1	H	H	이	H	H	CN	CH₂C≡CH	CF ₉
Me		H	H	O	H		CF,	CH3C≡CH	Me
Me :	1	H	H	미	H		Me	CH ₂ C≡CH	CF ₃
Me		Ħ	H	0	H		CF,	CH ₂ C≡CH	CL
1340		H	Ħ	₽	Ħ		CI	CH ₂ C=CH	CF ₈
Me		प्त	Ħ	0	H		CF _{\$}	CH2C=CM0	CI
A5e	1	н	H	8	Н		CI CI	CH ₂ C≡CM ₀	CF ₃
Me		н	H	이	H	Ħ	CI	CHF ₂	CI
392		H	H	0	_ ,	1	OCRF,	CHF ₂	CI
Me		Н		0	H	Ħ		CHF ₂	OCHF2
Me I		Н	H	0	H	1	OCHF,	CHF,	OCHF ₂
Me		H	H	0	H		CF ₀	CHF,	CI .
Me		H	- 1	0	H		CI	CHF:	CF ₈
Me		H	- 1	0	H		CP ₃	CHT:	F
Me		H	H	1	H	- 1	F		CF,
Mel		н		0	H				Ob/le
Med		H	H	0	H	- 1		CHP ₂	CP,
Med		H		0	H			CHP ₂ CHP ₃	ORt CE
Me		H		٥	H				CIF _G
Mel		H		ō	н				ochp, cp,
Mel	1	H	- 1	9	н			CHF.	•
Mol		H		0	H			7	CN CF _a
Me	1	H	1	ő	H		1		or _e
Ma		H	1	ŏ	H	H	*	-	CF ₂
Mel		H		8	H			- 1	CI CI
Me		H	н	o	н			3	Mie
Me		Ħ	н	o	н	- 1		CHF,	CI CI
Me		Ħ	н	0	Я				E4
				_	٠	لت	1		

[0095]

【表54】

(64)

125

特闘2002-308857

126

\mathbb{R}^1	B3	RB	R1	n	R ⁵	Re	Rap	R ²⁸	K ₂₀
Me	Me	Н	Н	0	H	H	CF,	OH ₂ CHF ₂	CI.
Me	Me	H	и	0	H	H	cı	CH, CHF,	CF.
Ma	Me	Ħ	н	o	H	H	CF ₂	CH ₂ CF ₂	α
Me	Me	H	Ħ	이	H	H	cı	CH ₂ CF ₂	CF _a
Me	Me	н	Ħ	0	Ħ	н	CF ₃	СН₃ОН	CI .
Me	Me	Ħ	Ħ	ø	R	H	cı ·	СН _в ОН	CF,
Me	Me	H	Ħ	Đ	Ħ	Ħ	ca i	CFI ₂ OMo	ପ
Me	D4e	ㅂ	H	9	H	Ħ	OCHF ₂	CH ₂ OMe	CI CI
Me	Ma	H	H	o	H	H	Cl	CH ₂ OMe	ochf,
Me	Me	H	H	0	H	H	ochp ₂	CH ₂ OMo	ochf,
	Ma	И	Ħ	0	H	H	CP,	CH ₂ OM ₀	P
Me	Me	H	H	P	H	H	F	CH ₂ OM ₀	CP3
Me	Me	H	H	미	H	H	CF _a	CH₂OMe	CI
Ma	Me	H	H	o	H	H	Cl	CH₂OMe	CF ₀
Me	Ma	H	H	0	H	H	CF ₂	CH ₂ OMe	GMe
Me	Me	И	H	이	H	Ħ	OMe	CH _e OMe	CP ₃
Me	Me	H	Ħ	٥	H	H	CF ₈	CH ₂ OM ₂	O£t
Me	Me	H	H	0	H	H	QE _z	CH ₂ OM2	CF ₃
Ma	Ma	H	H	0	H	H	CF ₃	CH₂OMe	OCHF ₂
Me	Mo	Ħ	H	0	H	H	OCHF2	CH₂OMe	CF ₈
Me	Me	H	Ħ	이	H	H	CF,	CH ₂ OMe	CN
Me	Me	Ħ	丑	0	H	H	CN	CH₂OMe	CF ₈
Mc	Mo	H	ㅂ	0	H	H	CF,	CH₂OMe	Me
Mc	Me	Ħ	H	0	H	H	Me	Cff ₂ OMe	CF ₈
190	Me	Н	Ħ	0	ਸ	Ħ	CF,	CH2OBt	a
Me	Me	H	Ħ	8	Ħ	प्त	CI	CH ₂ OE1	CF ₃
Me	Me	H	Ħ	0	H	Н	CIP.	СН•СП•ОН	CI .
Me	Me	H	H		H	Н	Ci	сн,сн,он	CF ₃
	Me	H	H	이	H	Н	CF3	CH ₂ CH ₂ OM ₀	cı
1 1	Mo	H	ij	이	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ OMe	CP ₀
Me		H	H	이	H		CF,	CH2CH2OBt	a
Ma		H	H	이	н	H	Ci	CH ₂ CH ₂ OBt	CP₃
Me		H	H	이	H	뜅	CF ₃	CH ₃ NHMe	CI
Мe		H	H	이	H	H	CI	CH₂NHMe	CP ₃
pyje		H	H	이	H		CF ₅	CH ₂ N(Mo) ₂	CI
	Me	H	H	이	Н	H	Cl	CH ₃ N(Me) ₂	CF ₂
	Me	H	H	이	H	H	CF2	CH ₂ N(M ₂)C(=0)M ₂	CI
	Me	H	H	9	H	H	Cl	CH ₂ N(Me)C(=0)Me	CF ₀
	Me	H	H	0	н	H	CF ₈	CH ₂ N(M ₂)C(=0)CF ₈	a
Mo	Ma	H	H	0	н	H	Cl	CH2N(Me)C(=O)CF ₂	CF,

[0096]

【表55】

(65)

127

特闘2002-308857

128

R2	R²	R3	Ré	n	\mathbb{R}^5	\mathbb{R}^6	R ²⁶	R ²⁶	R ⁸⁰
Mo	Mo	H	н	0	н	н	CF3	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	a	CH ₂ N(Me)SO ₂ Me	CF ₃
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	CP₃	CH2N(Me)SO2CITF2	CI
Me	Me	Ħ	Ħ	0	Ħ	Ħ	CI	CH ₂ N(Me)SO ₂ CHIV ₂	CF,
Me	Me	н	H	0	H	H	CPs	CH2N(Me)SO2CF2	a
340	Mo	H	H	9	H	Ħ	Cī	CH ₂ N(M ₀)8O ₂ CP ₀	CF ₃
Me	Me	н	H	ø	H	H	CP _s	CH₂8Me	a
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	CI.	CH₃8Me	CIP ₈
Me	Me	14	H	O	Ħ	H	CF,	CH ₂ SO ₂ Me	CI.
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	CI	CH ₂ SO ₂ Me	CP ₈
	Me	H	Ħ	이	H	H	CF ₈	CH ₂ CH ₂ SMe	CT CT
Me	Me	H	И	0	H	H	CI	CH1CH1SMe	CP ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₉	CH ₄ CH ₄ SO ₂ Mo	CI
Me	Mo	H	Ħ	o	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	CF,
Me	Me	Ħ	H	이	H	H	CF ₂	CH ₂ CN	CI
Ma	Ma	H	H	이	H	H	ପ	CH ₂ CN	CF ₈
Me	Me	Ħ	Ħ	0	Ħ	H	CF,	CH₂C(=C)OMe	CI
Me	266e	H	H	0	H	H	a	CH ₂ C(=0)0Me	CF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	CH ₂ C(=0)OB1	CI
Me	Me	H	H	0	H	H	a	CH ₂ O(=0)Offt	CF ₃
Me	Me	Н	н	0	Н	Ħ	CF ₃	CH(Me)C(=O)OMe	a
Me	Me	Н	H	0	Н	Ħ	a	CH(Me)C(=O)OMe	CF ₃
	Me	H	ឣ	0	H	Ħ	CP ₃	C(Me) ₂ C(=O)OMe	a
	Me	H	H	0	H	H	CI.	C(Me) ₂ C(=0)OMe	CF ₃
	Me	н	H	0	H	H	CF ₅	CH ₂ C(=0)NH ₂	ପ
Me	Me	н	H	0	H	H	a	CH ₂ C(=O)NH ₂	CF ₃
	Me	H	H	이	H	ਸ	CF,	CH ₄ C(=0)NHMe	ପ
	Me	H	H	0	H	Ħ	CI	CIL _I C(=0)NHMe	CP ₄
	Me	H	И	이	H	Ħ	CF ₃	CH ₂ C(=O)N(Me) ₂	C1 ,
	Me	H	H	뎩	H	Ħ	Cl	CH ₂ C(=0)N(M ₀) ₂	CF ₅
	Me	Н	H	이	H	H	CP ₈	CH ₂ C(=O)Me	CI
	Me	H	H	이	H	H	CI	CH ₂ C(=O)Me	CF ₂
1	Me	H	15	0	H	H	CF,	CH ₂ C(=NOMe)Me	CI
	Me	H	H	0	H	H	CI	CH ₂ C(=NOMa)Me	CF ₈
	Me	H	H	0	Ħ	H	CF,	CH ₂ C(=O)CF ₃	CI
	Me	H	H		R	H	CI	CH ₂ C(=0)CP ₃	CF ₈
	Me	H	Ħ	0	R	H	CP,	CH ₂ CH ₂ C(=0)Me	CI
1	Me	H	H	이	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ C(=0)Me	CF,
	Me	R	뾰	0	H	н	Mo	Ph	Me
Mo	Me	H	H	0	H	H	Me	Ph	<u>a</u>

[0097]

【表56】

(66)

特闘2002-308857

								(60)	12012005
			129	3					130
Rì	B ₃	Rª	R1	n	R ⁵	R ⁶	R ²⁰	K ₂₀	R ⁸⁰
Me	Me	H	H	0	H	H	E4	Ph	CI
Me	Me	H	Н	G	H	Ħ	Pr	Ph	cı
Me	Ma	H	н	0	H	H	Pr-i	Ph.	Cl
Me	Ма	H	Ħ	0	H	·H	Bu-t	Ph	Cl
Mc	Me	H	H	0	Ħ	H	CH ₂ OMe	Ph	Cl
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	Ħ	C)	Pa	C)
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	Ħ	ochf,	Ph	CI
Me	Me	អ	Ħ	0	H	H	ochp,	Ph	ochf,
Me	Me	н	H	ø	H	H	CHF2	Ph	Cı
Me	Ma	H	H	o	н	H	CF,	Ph	H
Me	Me	H	H	o	H	н	CP ₂	Ph	Ne
Ma	Mo	н	H	o	н	н	Me	PL	CF ₃
Me	Me	н	H	Ы	H	H	CF.	РЬ	Et.
Me	Me	H	Н	o	H	Н	CF ₃	Рь	Pr-i
Me	Mo	H	Н	0	h	H	CF,	Pb	CHF ₂
Me	Me	H	H	o	H	Ħ	CF ₈	Ph	CF ₈
Me	Me	Ħ	H	o	H	H	CF ₂	Ph	P
Me	Me	H	H	o	H	н	CF2	Pb	Ci Ci
Mo	Ma	Ħ	H	o	Ħ	H	CI	Ph	CF,
Me	Mo	н	H	0	н	H	CF ₃	Ph	OEI
Mc	Me	н	H	0	H	H	OH	Ph	CP _a
Ma	Ma	н	H	0	H	н	CF,	Ph	OM ₂
Me	Me	Ħ	H	0	Ħ	H	OMe	Ph	CF.
Me	Me	됷	Ħ	0	H	Ħ	CF:	Ph	OB:
340	Me	Ħ	ਜ	0	ਜ	Ħ	OEt	Ph	CF,
340	Me	H	я	o	Ħ	ĸ	CF _a	Pb	OPr-i
Ma	Me	Ħ	ਸ	Ð	Ħ	H	CF,	Ph	OP2
Mo	Mo	ਜ	Ħ	0	H	H	CP,	Ph	OBu-t
Me	Me	Н	H	0	H	H	CIP,	Ph	OCH _a Pr-c
Me	Me	Н	H	0	H	H	CF,	Ph	оснесн-сне
Me		H	H,	0	H	빒	CF,	Ph	och _g c=ch
Me	Me	H	H	ø	H	Ħ	CP ₃	Ph	OCHF ₁
Me		H	H	0	H	Ħ	OCHF2	Ph	CP,
Me		H	H	0	H	Ħ	CF ₃	Ph	och,chp,
Me	Me	H	H	이	H	н	CF3	Ph	OCH_CF1
	Me	H	H	0	H	H	CF8	PЪ	OCH ₂ O(=0)OMe
	Me	H	H	0	H	H	CF;	Рь	OCH(Me)C(=O)OMe
Me	Mo	H	Ĥ	0	H	H	CF,	Ръ	OC(Me) ₂ C(=O)OMe
	Mo	H	H	o	H	Ħ	CF,	Ръ	OC(=0)Me
Mc	Me	H	Н	0	H	H	CF ₃	Pb	0C(=0)Et

[0098]

【表57】

(67)

特闘2002-308857

								(0/)	1284 C A A & .
			131	L					132
R'	R³	R	R4	33	R5	$\mathbf{R}_{\mathbf{G}}$	R ²⁰	R18	R ^{so}
Ме	Me	Ħ	ਸ	0	Ħ	H	CF ₃	Ph	OC(=O)OH ₂ Ph
Me	Mo	K	Ħ	0	Ħ	Ħ	CP ₃	Ph	OC(=O)CF ₈
Me	Me	R	丑	Ð	Н	H	CP,	Ph	OC(=0)Ph
Mo	Me	표	H	0	H	H	CF ₃	Ph	OSO ₂ Me
Me	Me	H	Ħ	ô	Ħ	H	CP ₃	Ph	OSO ₂ Et
Me	Me	H	Ħ	Û	Ħ	Ħ	CF ₈	Ph.	OSO _t CH ₂ Ph
Me	Me	Ħ	H	0	H	Ħ	CF ₈	Ph.	OSO ₂ CF ₈
Me	Mə	Ħ	Ħ	0	H	H	CF ₈	Ph	060 ₂ Ph
Me	34e	Ħ	Ħ	0	н	Ħ	CF ₈	Ph	SMe
	Me	И	Ħ	0	H	H	CF ₈	Ph	80 ₀ Me
Ma	Me	Н	H	P	Ħ	H	CF8	Pb	8R1
Mo	Mo	H	Ħ	이	H	H	CF,	Ph	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	0	H	H	CF*	Ph	SPr-i
Mc	Mo	H	H	0	H	H	CF2	Ph	30₃P⊷i
Me	Mo	H	Ħ	0	Ħ	H	CF.	Ph	SP r
Mo	Mo	H	Ħ	0	H	H	CF ₃	Ph	SO₂Pr
Me	Me	H	H	0	H	И	CF ₃	<i>P</i> h	8 8 0-4
Me	Me	Н	H	0	H	н	CF ₈	Ph	SO₂Bu-t
34c	Me	H	H	이	H	H	CF _a	Ph	SCHF₂
	Me	H	H	이	H	H	CF,	Ph	SO ₂ CHF ₂
	Me	H	H	0	Ħ	Ħ	CF,	Ph	NH ₂
Me	Me	Ħ	Ħ	0	H	Ħ	CF ₂	Ph	NHMe
	Mo	Ħ	Ħ	0	H	H	CF,	Ph	N(Me);
	14c	H	Ð	0	H	H	CF,	Ph	NHC(=0)Me
1	Me	H	A	0	Ħ	Ħ	CF ₃	Pb	N(Me)C(=O)Me
	Me	H	Ħ	0	Ħ	ĸ	CF ₃	Ph	NHSO ₂ Mo
i	Me	H	Н	0	н	H	CF,	Ph	M(Ma)SO ₂ Mo
	Me	Ж	Ħ	0	н	н	CF,	Ph	nhso ₂ cp,
	Me	ਸ	Ħ	O	Ħ	प्त	CP ₃	Ph :	NOMSO ₂ CP ₄
1 1	Me	Ħ	Ħ	O	н	H	CP ₃	Ph	MHPh
	Me	Ħ	H	0	H	H	C₽ ⁸	Ph	N(Me)Ph
	Ma	H	H	0	H	H	CP ₃	Ph	CN
	Me	H	H	0	H	H	CP ₃	Ph	C(=0)Me
Me		H	H	0	H	H	CF3	Ph	C(=0)OMe
	lvie	H	H	٥	H	Ħ	CF ₆	Ph	C(=O)NII.
	Me	H	H	0	H	Ħ	CF ₈	Ph	C(=O)NHMe
1	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	Ph	C(=0)N(Mo) ₁
	Me	H	ы	미	Ħ	Ħ	CF8	Ph	lmidazol-1-yl
1 1	Me	H	H	미	H	H	CF,	Ph.	Pyrazol-1-yl
Me	Dis	H	H	0	H	H	CF,	Pb	1,2,4-Triazzl-1-yl

[0099]

【表58】

(68)

133

特闘2002-308857

R	\mathbb{R}^{2}	\mathbb{R}^8	R'	r.	Rg	R ⁶	R ²⁹	R ⁹⁵	R ⁸⁰
Me	Me	H	ਜ	0	Ħ	H	CP ₃	Ph	1,2,4-Triasol-4-yl
Me	Me	H	ਜ	0	Ħ	H	CP,	Ph.	Tetrazol-1-yl
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	CF,	Ph	Tetrazol-5-yl
Me	Me	H	H	0	Ħ	н	CF;	Ph	(4,6-
			ł	H					Dimethoxypyrimidin-2-
Me	Me	Ħ	я.	0	В	ਸ	CF.	Ph	y!)oxy (4.6-
				Ī					Dimethoxypyrimidin-2-
				П					yDeulfonyl
1 3	Me	Ħ	H	٥	H	H	CP,CF,	Pa	cı
1	Me	H	И	0	И	H	CF ₈	(2-CDPh	CI
	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	(2-F)Ph	Cl
	Me	Ħ	H	0	H	H	CF ₈	(2-QMe)Ph	Cl
	Me	H	H	0	H	H	CF,	(2-Me)Ph	CI
	Me	H	H	0	H		CF,	(2-NO ₂)Ph	CI
	Me	H	H	이	H	H	CF ₃	(2-CN)Ph	Cl .
	Me	H	Ħ	이	H	H	CF ₃	(2-C(=0)Ma)Ph	cı
	Me	н	H	0	н	H	CF ₃	(2-C(=0)OMe)Ph	CI
	Me	H	H	Đ	H	H	CF ₂	(2-C(=0)OEt)Pb	CI
	Me	H	H	이	н	H	CF ₃	(2·C(=0)OPr-i)Ph	CI
1	34o	Ħ	Ħ	0	H		CF ₃	(2-C(=O)NH ₂)Ph	CI
Me		H	Ħ	0	H	н	CP ₃	(2-O(=O)NHMe)Ph	a l
	Me	H	H	ø	H	H	CF ₃	(2-C(=0)NMe ₂)Ph	CI.
	Me	Ħ	H	아	н	H	CP ₃	(3-CD)Pb	Ct
Me		ㅂ	H	٥	H	H	CP ₃	(8- <i>P</i>)Pb	CI
Mo		Ħ	H	0	H		CP ₃	(\$-OMe)Ph	CI
Me	1	ㅂ	H	0	H		CF ₃	(3-Me)Ph	CI
Me		H	H	이	H	H	CF ₈	(3-NO₂)Ph	ca l
Ме		H	H	P	Ħ	Ħ	CF.	(3-CN)Ph	ca
Me		Ħ	H	٥	Ħ	Ħ	CF.	(3-C(=0)Me)Ph	a
Me		H	H	이	Ħ	H	CF ₈	(8-C(=0)OMe)Ph	cı
Me		H	ы	٥	Ħ.	H	CF ₀	(8-C(=0)OEt)Ph	a
Me	i	H	И	이	H	H	CF ₉	(3-C(=0)OPr-i)Ph	ପା
Me		H	H	٥	H	H	CF,	(3-C(=0)NH ₂)PL	CI.
Mo		H	H	O	H	H	CF ₅	(3-C(=0)NHMe)Ph	CI
Me		H	H	0	H		CF ₉	(8-C(=0)NMo ₂)Ph	ପ
Me	3	H	H	9	ĸ		CF ₈	(4-Ci)Ph	CL
Me		H	H	이	H		CF ₈	(4·F)Ph	Ct
Me		K	H	0	Н		CF ₃	(4-QMa)Ph	CI
Me		H	H	9	Ħ		CP _a	(4-Me)Ph	a
Me	7/20	H	표	0	H	Ħ	CT ₈	(4-NO ₂)Ph	CI

[0100]

【表59】

(69)

135

特闘2002-308857

136

R1	R ²	R8	R	n	$\mathbf{R}^{\mathbf{g}}$	\mathbb{R}^6	R ²⁰	R*5	R*4	
Me:	Me	н	H	0	н	H	CF ₃	(4-CN)Ph	C)	
Me	Me	H	ਸ	0	H	Ħ.	CP ₃	(4-C(=0)Me)Ph	a	
Me	Me	H	H	0	H	H	CF ₈	(4-C(=O)OMe)Ph	a	
Me	Me	R	Ħ	0	Ħ	Ħ	CF3	(4-C(=0)0Et)Ph	C1	
Me	Me	н	Н	0	H	H	CP _s	(4-C(=0)OP2-1)Ph	ca .	
360	Mo	H	H	0	Ħ	Ħ	CP ₃	(4-C(=0)NH ₂)Ph	a	
Me	Me	ਮ	H	Đ	H	H	CF ₅	(4-C(=0)NHMe)Ph	a	
Me	Me	H	H	0	H	Н	CF ₈	(4-C(=0)NMe _b)Ph	a	
λſe	Me	11	H	0	H	H	CF.	Pyrmidin-Lyl	CI CI	
Me	Mə	H	H	이	H	H	CF,	4,6-Dimethoxypyrmidin-2-yl	Cl	
	Me	H	Ħ	이	H	H	CF,	Thisphen-2-yl	Ct	
	Me	H	H	이	H	Н	CF ₂	Furan-&yl	CI	
Me	Me	H	H	이	H	H	CF ₃	90 ₂ N6c	ા	
Me	Me	H	H	이	H	H	CF,	SO ₂ Rt	CI	
Mo	Mo	H	H	미	H	H	CF ₉	50 ₂ Pr~i	Cl	
Mo	Mo	H	H	이	H	H	CF ₃	SO₂CIL₁Ph	Cr	
146e	Me	प्त	H	0	H	H	CF,	SO ₂ CHP ₂	Cl	
Me	Me	Ħ	R	이	H	H	CF:	so _t ce,	a	
Me	Me	H	H	이	H	H	CF _a	SO ₂ Ph	CI	
Me	Me	Ħ	H	0	H	Ħ	CF,	C(=O)Me	CI	
Me	Me	Н	H	0	H	Ħ	CF ₃	C(=0)Et	CI	
Ma	Me	H	H	0	H	丑	CF.	C(=0)Pr-i	Cl	
240	Me	H	H	0	H	H	CF ₃	C(=0)Bu-t	a	
Ma	Ma	H	H	0	H	Ħ		C(=0)Ph	a	
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	CF ₈	C(=O)CH ₂ Ph	a	
Me	Me	H	H	Û	H	H	CF ₈	C(=0)CR ₂ Cl	CA	
Me	Me	H	H	o	H	Ħ	CP ₃	C(=0)CF(Cl ₂	ପ	
Me	Me	H	Н	0	H	H	CF ₂	C(=0)CF ₃	ପ	
Me	Me	H	H	0	H	ਸ਼	CF ₈	C(=0)0Me	a	
Me	Me	H	Н	٥	H	ਸ	C₽ ₅	C(=0)0?b	CI	
Me	Me	H	H	0	H	ਸ	CF ₈	C(=0)OCH_Ph	CI	
	Me	H	Ħ	0	H	H	CF ₆	C(=O)NHMe	СІ	
	Me	H	H	٥	Ħ	R	CF ₈	C(=O)N(Me);	Cl	
1	Me	H	H	0	H	Ħ	CF ₃	C(=O)NHPb	CI.	
1	Me	H	H	O	H	H	CF _a	NH ₂	O.	
	Me	H	H	Ð	н	я	C)	-(Cif ₂) ₁		
	Me	H	H	٥	Ħ	Ħ	CI	≺CH [™] O-		
Me	Me	ĸ	Н	0	H	Ħ	CI	-(CH ₂) ₂ S-		
	Me	H	H	0	H	H	CI	-(CH ₂) ₃ SO ₅ -		
Mo	Me	鼠	H	0	H	Ħ	CP ₈	-(CH∂ ₂ O-		

[0101]

【表60】

(70)

137

特開2002-308857

-	20

\mathbb{R}^1	R ²	RB	R	n	R	R	R ²⁵⁰	R ³⁶	R ⁵⁰
Me	Me	H	И	0	H	H	CF,	-(CH ⁵⁾⁴ /) -
Me	Me	H	H	0	H	H	CF,	-(CH2)	g -
Me	Me	H	H	0	H	H	CF.	-{CH ₂) ₂ S	O ₉ .
Mo	Mo	Н	Ħ	o	H	H	OMe	-(CH ₂),	
Me	Me	н	Ħ	0	H	H	OCHF ₂	-(CH ₂).	•
H	H	H	Ħ	Ð	Ħ	H	CP3	Me	ପ
Me	H	H	Ħ	Ð	Ħ	Ħ	CF4	Me	CI
Me	Н	Me	Ħ	0	Ħ	Ħ	CF2	Me	CI
Me	Me	Me	H	0	H	н	CF ₂	Me	C1
Me	Me	H	H	9	Me	H	CF ₈	Me	C1
Me	Me	H	H	0	Εt	H	CP ₃	Me	cı 📗
Me	Me	H	H	٥	Pr-i	Ħ	CF ₃	Me	[CI
Mo	Me	Ħ	H	O	Me	Me	CF.	Me	CI
Me	•	H	H	٥	H	Ħ	CF ₃	Me	CI
Et	Et	H	H	0	И	Ħ	CF ₃	Me	Ci
Me	Pr-i	н	Ħ	0	И	H	CF ₈	Me	CI
Me		Н	H	0	H	H	CF _s	Me	CI
	Pr-c	H	H	o	H	H	CF,	Me	CI.
	CH,Pr-c	H	H	0	H	Ħ		Me	Ci
	(CH ₂) ₃ -	H	Н	0	H	H	CF ₃	Me	CL
1	(CH ₂) ₅ .	H	Н	0	H	H	_	Me	CI
	(CH ₂) _c	H	H	0	H		CF ₈	Me	CI
_	(CH ₂) ₅ -	H	Ħ				CF ₈	Me	CI
H			H			l .	CF,	Me	Cl
H			H	1			CF,	Me	Cı
H			H	0			CIT,	Me	a
H	-(CH ₂	6-	Ħ	0	स	Ħ	CF ₃	Ma	CI
Me	Bŧ	17	B	2	H	H	11	H	н

[0102]

【表61】

(71)

139

特開2002-308857

140

	R' R									
				N	R R	R82				
$\mathbf{B}_{\mathbf{I}}$	R ²	\mathbb{R}^8	R4	П	\mathbb{R}^5	R	Z 8	R ⁸¹	R ²⁸	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	Me	F	
Me	Me	Ħ	И	2	H	H	0	Me	C1	
Me	Me	H	Ħ	2	Ħ	Ħ	0	Mo	OMe	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	Me	OBt	
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	0	Me	OPr-i	
Me Me	Me Me	H	H	2 2	H	H	0	Me Me	OPh OCHP,	
								Me	_	
Me Mo	Me Me	H H	H	2	H H	H H	0	Mo	Me CF ₈	
Me	Me	н	H	2	н	Ħ	o	Me	CN	
Me	Me	H	H	2	Ĥ	H	ŏ	OCHF.	F	
Me	Me	H	Ħ	2	н	H	0	OCHE	Ca Ca	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	OCHP ₂	Me	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	OCHP ₂	CF ₃	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	OCHP ₂	CN	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CP _a	F.	
Me	Mo	H	H	2	H	H	0	CF ₃	CI	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	OM ₀	
Me	Me	H	H	2	H	H H	0	CF ₃	OEs. OPr-l	
Me Me	Me Me	H	H H	2	н	H	0	CF ₅	OPh	
Me	Me	13	H	2	Ħ	H	0	CF ₈	OCHF ₂	
Me	Me	H	H	2	Ħ	н	lő	CF ₃	SMe	
Me	Me	H	H	2	н	H	o	CF ₃	SOMe	
Me	Me	H	H	2	H	H	ō	CF ₃	SO ₂ Me	
Me	Me	H	H	2	н	H	0	CF2	SEt	
Me	Me	Ħ	Ħ	2	H	Ħ	0	CF ₃	SOEt	
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	0	CF ₈	SO ₂ Et	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF.	SPr-i	
Me	Me	Ħ	H	2	H	Ħ	0	CP ₈	SOPr-i	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	SO ₂ Pr-i	
Me Me	Mo Me	田田田	H	2	H	H	0	CF ₈ CF ₂	SPh Soph	
Me	Me	H	H	2	H	H	o	CF ₃	SO ₂ Ph	
Me	Me	Я	н	2	H	H	o	CF ₃	SCHF ₂	
Me	Me	H	н	2	н	H	ŏ	CF.	SOCHF,	
Me	Me	H	H	2	H	H	ŏ	CF ₈	SO ₂ CHP ₂	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₂	SCF ₃	
Me	Me	Ħ	Ħ	2	Н	H	0	CF ₃	SOCF ₈	
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF8	SO ₂ CF ₃	

[0103]

【表62】

(72)

特闘2002-308857

						716	,		1300 0 0 0 0
		147							142
R1	B ²	\mathbb{R}^8	R'	n	\mathbb{R}^{ε}	R ^o	\mathbf{Z}^{a}	R ³¹	R ^{na}
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	O	CF,	NH ₂
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	0	CP,	NHC(=0)Me
Mo	Me	Ħ	H	2	H	H	0	CF,	NHC(=0)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	NHO(=O)CH ₂ Pb
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	0	CF _a	NHC(=0)CF ₈
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	0	CF,	NHSO ₂ Me
Ме	Me	H	H	2	H	H	jo	CF ₅	NHSO ₂ Ph
Mo	Me	H	H	2	H	H	Ю	CF8	NHSO ₂ CHF ₂
Ме	Me	Н	H	2	Ħ	Ħ	0	CF ₃	NHSO ₂ OF ₃
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	NHMe
Me	Me	И	Н	2	H	13	0	CIF ₃	NHPh
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF3	N(Mo)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)C(=O)CH2Ph
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₈	N(Me)C(=O)CP ₈
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Mo	Me	H	H	2	H	H	0	CF ₃	N(Me)SO,Ph
Me	Me	н	H	2	H	H	О	CP _a	N(Me)SO_CHF,
Me	Me	H	Ħ	2	Ħ	Ħ	0	CP _a	N(Me)SO ₂ CP ₂
Me	Me	H	H	£	H	Ħ	0	CF ₈	N(Me)
Me	Me	н	H	2	H	H	0	CF ₈	N(Me)Pb
Me	Me	н	H	2	Ħ	FI	0	CF ₉	Me
Me	Me	H	H	٤	H	H	0	CF ₈	CF ₆
Me	Me	H	H	2	H	H	0	CP,	CN
Me	Me	н	H	2	11	H	o	Ph	Me
H	H	H	H	2	H	H	0	CF ₈	Me
Me	Ħ	Ħ	H	2	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Ħ	Me	H	2	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Me	Me	H	2	H	H	0	CP ₃	Me
Me	Mo	H	H	2	Me	H	0	CF ₃	Me
Me	Ma	н	H	2	Et	H	0	CF ₃	bie
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	0	CF ₈	Me
Me	Me	H	Ħ	2	Me	Me	О	CF ₂	Me
Me	Et	H	H	2	14	H	0	CF ₃	Me
Et	Et	H	Н	2	Ħ	H	0	CF ₃	Me
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	0	CF ₅	Me
Me	Pr	H	H	2	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Pro	H	Ħ	2	Ħ	H	0	CF ₃	Ma
Me	CH ₀ Pr-c		H	2	H	Ħ	0	CIF ₈	Me
(CH ₂)		Ιŧ	H	2		Ħ	0	CF ₃	Ma
(CH ₂)	3-	田	H	2	Ħ	H	0	CF _a	Me
(CH ₂)		斑	H	2	H	H	0	CF ₃	Me
(CH ₂)		H	Н	2		Ħ	0	CF,	Me
FI	·(CH ₂) ₈ -		H	2		H	0	CF ₂	Me
H	-(CH ₂)4-		Н	2		H	o	CF ₂	Me
	(ATERIA)		1	12			<u> </u>	100 10	J

[0104]

[表63]

(73)

143

特闘2002-308857

144

\mathbb{R}^{1}	R ⁸	\mathbb{R}^3	R ⁴	D	\mathbb{R}^5	R ^o	Z ³	R31	R ^{5/2}
H	-(CH ₂) _b -		H	2	H	H	0	CF ₃	Me
H	-(CH ₂) ₆ -		н	2	Ħ	Ħ	0	CP ₃	Me
Me	Me	H	н	2	И	H	S	Me	F
Me	Me	H	н	2	H	H	S	Me	CI
Me	Me	Ħ	H	2	H	Ħ	3	Me	OMe
Mo	Me	H	H	2	H	H	s	Me	OEt
Me	Me	H	H	2	H	H	s	Me	OPr-i
Me	Me	H	н	2	H	H	S	Me	OPh
Me	Mo	H	Ħ	2	H	H	S	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	2	ĸ	11	8	OCHF2	P
Me	Me	H	H	2	H	H	s	OCHF ₂	CI
Me	Me	H	田	2	H	H	s	OCHF2	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	s	OCHF ₂	CP,
Me	Me	H	H	2	H	H	s	OCHF ₂	CM
Me	Mo	H	H	2	H	H	s	CF ₃	F
Me	Me	H	H	2	H	H	8	CF ₂	CI CO
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₈	CIM6 OEt
Me Me	Me	H	H	2	H H	H	s	CF _s	OPh
Mo	Me Me	H	H	2 2	и Н	Ħ	g	CF ₈	OCHIF.
Me	Me	н	н	2	H	H	S	CF ₃	SMs
Me	Me	H	H	20	н	H	9	CF _a	SOMe
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CP ₃	SO ₂ Me
Me	Me	Ħ	H	2	Ħ	H	S	CF ₃	SEL
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₂	SOEt
Me	Me	H	H	2	H	H	s	CF2	SO ₂ Et
Me	Me	н	H	2	н	H	ន	CF ₂	SPc-i
Me	Me	H	H	2	H	H	S	CL ²	SOPr-i
Me	Me	H	H	2	H	H	8	CF ₃	SO-Pri
Me	Me	H	Н	2	H	H	s	CF ₃	6Ph
Me	Me	н	Ħ	2	H	H	8	CF _s	SOPb
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	s	CF ₈	SO ₂ Ph
Mo	Me	н	H	2	H	H	S	CF _B	SCHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	8	CF ₃	SOCHP,
Me	Me	H	H	2	¥í	H	ន	CF.	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	Ħ	2	H	Ħ	S	CF.	SCF,
Me	Mo	H	H	2	Ħ	Ħ	ន	CF,	socf.
Mc	alá	H	H	2	H	H	s	CF ₅	SO ₇ CF ₃
Me	Mo	H	H	2	H	Ħ	8	CF ₂	NH ₂
Me	Mo	H	H	2	H	H	S	CF ₈	NHC(=0)Me
Me	Me	H	H	2	K	H	8	CF ₃	NHC(=0)Ph
Me	Me	H	H	2	14	H	8	CF _s	NHC(=0)CH ₂ Pb
Me	Me	H	H	2		H	S	CF ₃	NHC(=0)CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	H	8	CF ₃	NHSO₂Me
Me	Mo	П	H	2	H	H	S	CF ₈	NHSO ₂ Ph

[0105]

【表64】

(74)

特闘2002-308857

						(/1	7			1000 2 (0 0 2
		145								146
\mathbb{R}^1	R ²	\mathbb{R}^3	\mathbb{R}^4	n	\mathbf{R}^{5}	R^{σ}		Z	R ³¹	R ^{Se}
Me	Me	Н	H	2	H	H	8		CP ₈	NHSO, CHIP,
Me	Me	Н	H	2	H	H	s		CF ₃	NHSO ₂ CF ₈
Me	Me	Ħ	H	2	H	Ħ	8		CP ₃	NHMe
Me	Me	н	H	2	H	H	S		CF₃	NHPh
Me	Me	H	H	2	H	H	3		CF ₃	N(Me)C(=0)Me
Me	Me	H	H	2	H	H	s		CF ₈	N(Mo)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	S		CIF₃	N(Me)C(=O)CH ₂ Ph
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	ŝ		CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₈
Me	Me	H	H	2	H	13	8		CIF ₈	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	8		CIF ₈	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	K	H	2	H	H	8		CF ₀	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	S		CF ₈	N(Me)SO ₂ CF ₅
Me	Me	H	H	2	Ħ	Ħ	S		CF ₈	$N(Me)_2$
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	s		CF ₈	N(Me)Pb
Me	Me	Н	Ħ	2	H	H	3		CP_3	Me
Mo	Me	Ħ	H	2	H	H	ន		CF ₈	CN
H	H	H	H	2	H	H	S		CF ₂	CI
Mo	H	Ħ	Н	2	H	H	S		CF ₈	CI.
Me	н	Me	H	2	H	H	S	-	CP ₃	a
Me	Me	Me	H	2	H	H	S		CF ₈	
Me	Me	H	H	2	Me	, H	8		CF,	a
Me	Me	H	H	2	Eŧ	E I	s		CF ₃	CI
Me	Me	H	H	2	Pr-i	H	8		CF ₈	a
Me	Me	H	H	2	Me	Me	g		CP ₃	a
Me	Et	H	H	2	H	H	S		CF,	a
Et	Et	H	H	2	H	H	8		CF ₈	a
Me	Pr-i	H	H	2	H	H	S		CF₃	a
Me	Pε	H	H	2	H	H	S		CF ₃	CI CI
Me	Prec	H	H	2	Ħ	H	5		CF ₃	a
Me	CH ₂ Pr-c		Ħ	2	H	H	8		CF ₃	CI
(CH ₂)	3	H	H	2	Ħ	H	s		CF ₃	CI.
(CH2)		H	Ħ	2	H	H	S		CF _{\$}	CI
(CH ₂).		H	H	2	H	H	s		CF ₈	CI
(CH ₂)	5	H	Ħ	2	H	H	8		CF ₃	[CI
H	-(CH ₂) ₃ -		H	2	H	H	s		CF ₈	Cı
H	-(CH ₂)4-		Ħ	2	H	Ħ	s		CF ₈	CI
H	-(CH ₂) ₅ -		Ħ	2	H	Ħ	S		CF ₈	CI
H	-(CH ₂)6.		H	2	H	H	8		CF ₈	CI
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	0		Me	r
Mo	Me	н	H	i	H	H	0		Me	Cı
Me	Me	H	H	i	H	Ĥ	o		Me	OMe
Me	Me	H	н	1	H	H	ŏ		Mo	OEt
Me	Me	H	H	i	H	Ĥ	o		Me	OPri
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	o		Me	ОРЬ
Me	Me	Ħ	H	ī	K	Ĥ	ŏ		Me	OCHF ₂
			<u>-</u>	-						

[0106]

【表65】

(75)

特閱2002-308857

4	40

	R1	R ²		-3	T =			_	T						149	
	Me		-	R3			n R		R ⁶			Z^{\emptyset}	R ⁸¹	_	R ³²	_
	Me			H	I F	E	1 H		Ħ		0		Me		Me	_
		1		-	1 -	. 1	1 н		H		O		Me		CF ₂	
	Me Me			Ħ	ŀ	1	1 H		H	ŀ	0		Me		CIN	
	Mo			Ħ	ľ		1 H		H		Ō		OCHP.		F	
	Me			H	E		1 H		H		0		OCHF.		a	1
	Me			H	E		1 H		н	ŀ	0		OCHF,		Me	
			- 1	H	H		H		H		0		OCHT2		CF _a	- 1
- [Me	Mo		H	H		Н	ł	H	ŀ	0		OCHF,		CN	- 1
Į	Me	Me		Ħ	H		14		H	k	•		CF ₈		ľ	
ı	Me	Me		H	H		H	- 1	H	- ic	3		CF ₃		CI.	ı
-	Me	Me		H	H		H H	- 1	H	k	•		CF,		OMe	
١	Me	Me		H	H	ij	H	- 1	H	k			CF,		OE2	ſ
-	Me	Me		H	H		H	- 1	H	k			CF ₃		OPr-i	
1	Me	Me		H	H			ı	H	lo			CF _s		OPh	- 1
١	Me	Me		H	H	1	H		H	C			CF ₃		OCHF ₂	- 1
1	Mo	Me	1	Ŧ	H	1	H	ļ	H				CF ₈		orite Sale	- 1
1	Me	Me		E	H	1	И	- 1	H	ď			CF ₃		SO _e Me	- [
1	Me	Me	I	₹	H	h	H		Ħ	la			CF,		so _{errie} Sei	-1
ı	Me	Me	I	1	Ħ	1	H	-1	H	lo			CF ₃			-
ı	Мe	Me	F	Σĺ	Ħ	1	Ħ	ı	Ħ	lo			CF ₈		O₂Et	-1
1	Me	Me	Ŀ	1	Ħ	1		1	H	0			CP,		Pr-i	-1
L	Me	Me	ŀ	ij	Ħ	1		1	H	lo			CP ₈		O _p Pr-i	1
ı	Me	Me	E	[]	H	1	H	1	H	lo			OP OP		Ph	I
	Mo	Me	H		H	1	H	1	H	lo			CF ₈	0	O.Ph	1
L	Mo	Me	H		H	1	H	1	Ħ	0		- 1	CF ₈	15	CHP ₂	1
ı	Me	Me	H		H	1	H	1	H	0		i	CF,	8	O ₂ CHF ₂	1
l	Mo	Me	H		H	1	H	1	H	6		ı	CF ₈		CF ₈	1
L	Me	Me	Ŀ		H	1	H		Ħ	0		- 1	CF _a		O _z CF _a	1
	Me	Me	H		H	1	H		H	0		- 1	CF ₈		H ₂	İ
١.	Me	Mo	H		H	1	H	1	H	0		- {	CF ₈	N	HO(=0)Me	
	Me	Me	Ħ			i	H	1	H				CP,	N	HC(=0)Ph	
1	Me	Me	H			1	H	1	H	0			CF ₂	N	HC(=0)CH ₂ Pl)	1
	Me	Mo	H			1	H	1	H	0			CF _a	N	HC(=0)CF ₈	
	Me	Me	H			i	H		H	0			CF ₂	IN.	H8O _s Me	ı
	Me	Me	H			i	H	ı		0			CF ₃	N.	HSO ₂ Ph	1.
	Me	Me	Н			i	14		H H	0			CF2	N	HSO ₂ CHF ₂	Ł
1	Ие	Me	н			i	Я	1		0			of,	И	HSO ₂ CF ₂	ł
3	We	Me	Н			1	H	l	H	0			F3		НMe	
	Me	Me	Н	li		إر	Н	ļ	H	0		I	CF ₃		HPh	1
Ę	de	Me	H	Ē		i	Ħ	L	H	0		I	T,	N(Me)C(=0)Me	l
	Œ	Me	н	Ė		i	H		H	0		lo	F ₈	N(Me)C(=0)Ph	ı
	de l	Me	H	Ė		1	H		H	0			F ₂	N(Mo)C(=O)CH ₂ Ph	ı
	de l	Me	Н	ī		1	H		H	0		Ι¢	T,	N(Me)C(=O)CF	ľ
	4e	Me	H	Ī		i	Ħ	l	H	0		lc	F ₃	N(Me)SO ₂ Me	1
	fe	Me	H	Ē		í	H		H	0			F.	NÇ	Me)SO ₂ Ph	l
			77	-	Ŀ	1		L_	H	0		[0	T.	N(Me)SO ₂ CHP ₂	i

[0107]

46 【表66】

(76)

特闘2002-308857

						(10)	•		1980 5 0 0 5
		149							150
\mathbb{R}^{1}	\mathbb{R}^2	R	\mathbb{R}^4	n	\mathbb{R}^{5}	R ^e	Z ⁸	R81	R ³²
Me	Me	H	El	1	Ħ	H	0	CF,	N(Me)SO ₂ CF ₈
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF,	N(Me) ₂
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	0	CF ₈	N(Me)Ph
Me	Mo	쁘	H	1	H	H	0	CF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	0	CF ₉	CF ₃
Me	Me	Ħ	H	1	H	Ħ	0	CIF ₂	CN
Mo	Me	H	H	1	H H	H H	0	Pb CF,	Me
H Me	H H	H	H	1	H	A	0	CF ₃	Me Me
Me	H	Me	H	1	H	Н	ő	CF ₃	Me
Me	Me	Me	H	1	H	H	ŏ	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	i	Me	H	ŏ	CF ₈	Me
Me	Mo	H	H	ī	Et	H	õ	CF,	Me
Bile	Me	H	Ħ	ī	Pr-i	H.	o	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	ī	Me	Me	ō	CP _a	Мо
Mo	Et	Ħ	H	1	H	H	0	CP ₃	Ме
Et	Rt	H	Ħ	1	H	Ħ	0	CF ₃	Ме
Me	Pr-i	H	H	1	H	H	О	CF ₈	Me
Me	Pr	H	H	1	H	Ħ	0	CF ₂	Me
Me	Pr-c	н	H	1	H	H	0	CF ₈	Mo
Me	CH ₂ Pr-c		Н	1	H	H	0	CF,	Me
(CH ₂)		H	Ħ	1	H	H	0	CF ₃	Me
(CH ₂),	5*	н	H	1	H	H	0	CF ₈	Me
(CH ₂).	÷*	H	Н	1	H	H	0	CF ₂	Me
(CH ₂)		H	H	1	H	H	0	CF _*	Me
H	-{CH ₂ } ₃		Н	1	H	H	0	CF ₃	Me
H	-(CH ₂),-		H	1	н	H	0	CF _s	Мe
H	-(CH ₂) ₈ -		Н	1	н	H	0	CF,	Me
H	-(CH ₂) ₆ -		н	1	Ħ	H	0	CF ₂	Me
Ma	Me	Н	н	1	H	H	S	Me	F
Me	Me	H	Ħ	ī		H	s	Me	CI CI
Me	Me	H	H	1		H	8	Me	OMe
Mo	Me	H	Ħ	1		н	s	Me	OEt
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	s	Me	OPr-i
Me	Me	H	Н	1	H	H	S	Me	OPh
Me	Me	H	H	1		H	S	Me	OCHP ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	S	OCHF ₈	F
Me	Me	H	H	1	H	丑	S	OCHF,	Cl
Me	Me	H	H]	H	H	8 S	OCHP ₃	Me
Me Me	Me	H	H	1		H	8	OCHF:	CIF ₈
Me	Mo	H	п	1		Н	8	CF ₈	P CN
Me	Me	H	H	i		н	8	CF ₃	ca
Me	Me	H	H	וֹן		н	s	CF ₃	OMe
Me	Me	н	H	li	19	H	s	CF ₈	OEt
	1 200	T	1 44	Ľ	1			1~- 6	

[0108]

【表67】

(77)

151

特闘2002-308857

152

R ¹	R ²	\mathbb{R}^8	R ⁴	'n	\mathbf{R}^{5}	R ⁶	Z ⁸	R^{31}	R
	Me	Ħ	H	ī	H	Ĥ	8	CF ₃	OPh
Me	Me	H	H	1	Ħ	Н	S	CF ₂	OCRF2
Mo	Me	H	H	1	H	H	3	CF ₅	SMe
Me	Me	H	H	1	H	H	s	CF ₈	SO ₂ Ma ₂
Me	Me	Ħ	H	ג	Ħ	H	S	CF ₃	SEt
Mo	Me	H	H	2	H	H	S	CF ₃	SO ₂ Et
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	S	CF ₅	SPr-1
Me	Me	H	H	1	H	H	3	CF ₈	SO ₂ Pr-i
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	ន	CF ₃	SPh
Me	Me	H	Ħ	1	Ħ	H	S	CF ₈	SO ₂ Ph
Me	Me	И	H	1	H	111	ន	CF ₃	SCHF,
à le	Me	H	H	ı	H	н	S	CF ₈	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	1	H	H	s	CF ₃	SCF,
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	SO ₂ CIF ₃
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	S	CF ₅	NH ₂
Me	Me	Ħ	H	1	Ħ	丑	s	CF ₈	NHC(=0)Me
Me	Me	н	H	1	Ħ	Ħ	s	CF,	NHC(=0)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	8	CF ₈	NHC(=0)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	ន	CF _a	NHO(=0)CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF,	NHSO _e Me
Me	Mo	H	H	1	H	Ħ	s	CF3	NHSO,Ph
Me	Me	н	H	1	H	H	S	CF ₃	NHSO2CHF2
Me	Me	Н	H	1	H	H	8	CF ₃	NHSO2CF3
Ме	Me	н	H	1	H	H	ន	CF ₈	NHMe
Me	blo	H	Ħ	1	H	H	S	CF ₃	NHPh
Me	Me	H	H	£	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=O)Me
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	S	CF3	N(Me)C(=0)Ph
Me	Ma	H	H	1	H	H	ន	CF ₅	N(Mo)C(=O)CH _a Ph
Me	Me	Ħ	Н	ı	H	H	ន	CF ₈	$N(Me)C(=0)CF_3$
Me	Me	H	R	1	Ħ	H	8	CF ₂	N(Me)SO ₂ Me
Ms	Me	H	H	1	H	H	ន	CF ₂	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	S	CF ₃	N(Me)SO2CHF2
Me	Me	H	H	1	H	H	8	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₈
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	8	CP ₅	N(Me) ₂
Me	Me	Н	H	1	H	H	8	CP,	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	1	H	H	8	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	s	CF,	CN
H	H	H	H	1	H	H	8	CF _a	CI.
Me	Ħ	H	H	1	H	H	ន	CF ₈	CI
Me	H	Me		1	H	H	8	CF ₃	CI
Me	Me	Me		1	H	H	s	CF ₃	CI
Me	Me	Ħ	H	1	Me	H	ន	CF ₃	CI
Me	Me	H	H	1	Et	H	5	CF ₃	[CI
Me	Me	H	H	1	Pr-i	H	S	CF ₈	a
Me	Me	H	H	1	Me	Me	S	CF _s	CL

[0109]

49 【表68】

(78)

153

特闘2002-308857

-	E 4

R ²	R ²	\mathbb{R}^3	\mathbb{R}^4	n	${ m R}^5$	$\mathbb{R}^{\mathfrak{q}}$	Z³	R ³¹	R ^{SE}
Me	Et	H	Ħ	ī	H	H	8	CF ₈	CI T
Et	Et	H	H	1	H	H	S	CF _s	a
Me	Pr-i	Ħ	H	1	Ħ	H	ន	CF ₃	CI
Me	Pr	H	H	1	H	H	S	CF ₃	C1
Me	Pr-c	Ħ	H	1	H	H	9	CF ₃	OI.
Ma	CH ₂ Pr-c	H	и	1	H	H	S	CF ₃	Cl
(CH ₂),	-	H	Ħ	1	H	H	S	CF ₂	CI.
(CH ₂)		H	H	1	Ħ	H	3	CF ₈	CI.
(CH)		П	Ħ	ı	Ħ	H	S	CF _B	CI CI
(CH ₂)	.	H	H	1	H	H	8	CF ₃	CI.
H	-(CH ₂) ₃ -	_	H	1	H	H	8	CP ₃	cı
Ħ	-(CH ₂) ₄ -		H	1	H	Ħ	ន	CP ₈	a
H	-(CH ₂) ₅ -		H	1	H	H	S	CF,	ci
H	-(CH ₂) ₆		H	ì	Ħ	E	ន	CF ₉	ci
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	0	Me	F
Me	Mo	H	H	0		H	o	Me	r CI
Me	Me	н	H	0		H	0	Me	OMe
Me	Me	H		0		H	0	Me	OEt
Me	Me	H	H	0		H	o	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	ŏ	H	H	o	Me	OPh
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	ŏ	Me	OCHIF ₂
Me	Me	H	Ħ	٥	H	н	o	Me	Me
Me	Me	H	Ħ	ō	Ħ	Ĥ	ō	Me	OF,
3.5e	Me	H	H	0	Н	H	0	Me	CN
Me	Me	H	ы	0		H	Ō	OCHF ₂	F
Me	Me	H	Н	Û		H	0	OCHF2	CI CI
Me	Me	H	H	0		H	0	OCHF ₂	Me
Me	Me	Н	H	0		H	0	OCHF2	CP _a
Me	Me	H	H	0	H	H	0	OCHL ³	CN
Me	Me	H	H	Ð	H	H	0	CF _a	P
Me	34c	H	H	0	H	H	0	CF ₈	C1
Me	Me	H	Ħ	0	H	Ħ	0	CF ₈	OMe
Me	Me	H	H	Ü	H	Ħ	0	CF ₈	OEt
Me	Me	H	H	0		H	0	CF ₈	OPr-i
Me	Me	H	H	0		H	0	CF,	OPh
Me	Me	Ħ	H	0		H	0	CF ₉	OCHF ₂
Ma	Me	H	H	0		H	0	CF ₃	SMe
Me	Me	H	H	0		H	0	CF ₈	SO ₂ Me
Mo	Me	H	H	0		H	0	CF ₃	SEt
Me	Me	H	H	0		H	0	CF ₅	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	0		H	0	CF ₈	SPr-i
Me	Me	H	H	0		H	0	CF ₃	SO ₂ Pr-i
Me	Me	I	H	٥		Ħ	0	CF ₂	SPh
Me	Me	H	H	0		н	0	CF ₈	SO,Ph
Me	Me	l tr	L"	0	Ħ	H	<u> </u>	CF8	SCHF2

[0110]

【表69】

(79)

特闘2002-308857

						ζr υ,	,		1300 0 4 3 0
		155							156
\mathbb{R}^{1}	\mathbb{R}^3	\mathbb{R}^3	R4	n	R ⁵ H	R ⁶ H	Z^3	R ⁵¹	R ^{SII}
Mo	Me	Ħ	H	Ū			O	CF ₈	SO, CHF.
Me	Me	Ŀì	H	Ð	H	H	0	CF _s	SCF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	SO ₂ CF ₃
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	0	CF ₃	NH ₂
Me	Me	H	H	G	H	H	0	CF ₃	NHC(=0)Me
Me	Mo	H	H	Û	H	H	0	CF ₃	NHC(=0)Ph
Me	Me .	H	H	0	H	H	0	CF ₈	NHC(=0)CH_Ph
Me	Mo	H	Ħ	0	Ħ	H	0	CF ₃	NHC(=0)CF ₃
Me	Me	H	H	0	ы	H	0	CF ₃	NHSO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	NHSO ₂ Ph
Me	Me	H	Ħ	0	B	Ħ	0	CP ₀	NHBO ₂ CIOF ₂
Me	Me	班	H	0	H	H	0	CF ₈	nhso _s cf _s
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	NHMe
Me	Me	H	Н	0	H	Ħ	0	CF ₉	NHPh
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	0	CF ₃	N(Me)X(≔O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₈	N(Me)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	0	CP ₃	N(Me)C(=O)CH2Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	N(Me)C(=O)CF ₈
Mo	Mo	H	H	0	H	H	O	CF ₃	N(Me)SO ₂ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	N(Me)SO ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	N(Me)SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF;	N(Me)SO ₂ CF ₃
Me	Mie	H	H	0	H	H	0	CF ₃	$N(Me)_2$
3.0je	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	0	CF ₃	N(Me)Ph
Me	Mo	H	Ħ	ø	H	R	0	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	CF ₃	CF ₈
Me	Me	H	H	Û	H]	H	0	CF3	CIN
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	Ю	Ph	Mo
H	H	H	H	0	H	H	0	CF ₈	Ma
Me	H	H	H	0	H	H	0	CF _n	Me
Me	H	Me	H	Ð	Ħ	H	0	CF ₈	Me
Mo	Me	Me	Н	0	H	Ħ	0	CF,	Mo
Me	Me	H	H	0	Me	H	0	CF ₃	Me
Me	Mo	H	H	0	Et	Ħ	0	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	0	CF,	Me
Me	Me	H	H	0	Me	Me	0	CF ₃	Me
Me	Et	H	H	0	H	H	0	CF ₃	Me
Eτ	Rt	H	Ħ	0	H	H	0	CF ₃	Mo
Me	Pr-i	H	H	0	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Pr	H	H	0	H	H	0	CF ₃	Me
Me	Pr-c	H	H	0		14	0	CF,	Me
Me	CH ₂ Pr-c		H	0	H	Ħ	0	CF2	Me
(CH ₂)		H	Ħ	0	H	Ħ	0	CF ₃	Me
(CH ₂)	8-	H	н	0	Ħ	H	0	CF _s	Ma
(CH ₂)	r	Ħ	H	0	H	н	0	CF ₃	Me

[0111]

【表70】

<u>1</u>57

		T)/		_					158
R1	\mathbb{R}^8	\mathbb{R}^{s}	R4	n		R ⁰	\mathbf{Z}^{8}	R ⁸¹	R ⁵⁸
(CH ₂)		H	H	0	H	H	0	CF,	Me
H	-(CH ₂)3-		H	0		Ħ	0	CP,	Me
H	-(CH ₂)4-		H	O	H	H	0	CF ₃	Me
H			H	٥	H	H	0	CF.	Me
H	-(CH ₂) ₆ -		H	0		H	0	CF ₃	Me
Me	Me	Н	H	o	H	H	8	Me	F .
Me	Me	Н	H	0		H	S	Me	la `
Me	Mo	H	H	0		н	g	Me	OMe
Me	Me	Ħ	Ħ	0	н	H	S	Me	OEs
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	8	Me	OPr-i
Me	Me	H	H	O	Ħ	H	8	Me	OPh
Me	Me	H	H	0		H	s	Me	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0		Ħ	S	OCHF ₂	F
Me	Me	H	H	0	Ħ	Ħ	s	OCHF.	a
Me	Me	H	Н	0	H	H	s	OCHF ₂	Мө
Me	Me	H	H	0		H	S	OCHF ₈	CF ₃
Me	Me	H	H	0	Н	H	g	OCHP ₂	CN
Me	Me	H	H	0	H	H	ន	CF ₈	F
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	s	CF ₃	CI.
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	8 S	CF ₃	OMe OTT
Me	Me Mo	H	H	U Q	H H	H	8 8	CF ₂	OEs OPb
Me	Me	H	Н	0	H	H H	S	CF ₂	OCHF.
Me	Me	H	Н	0	H	H	S	CF ₃ CF ₃	SMe
Me	Me	Н	Н	0	н	H	S	CF ₃	SO ₂ Me
Me	Me	н	H	0	Ħ	H	S	CF ₃	SD:
Me	Me	H	H	0	н	H	s	CF ₂	SO ₂ Et
Me	Me	H	H	0	н	H	ŝ	CF.	SPr-i
Me	Me	Ĥ	H	ő	H	H	S	CF,	SO ₂ Pr-i
Me	Me	Н	H	0	H	Ħ	š	CF ₃	8Ph
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	s	CF ₈	SO ₂ Ph
Me	Me	Ħ	H	0	Ħ	Ħ	s	CF.	SCHP.
Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF.	SO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	9	CF ₈	SCP ₈
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF3	SO ₂ CF,
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	8	CF ₃	NH
Me	Me	H	H	0	13	H	8	CF ₈	NHC(=O)Me
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF3	NHC(=O)Ph
Me	Mo	H	H	0	PI	н	g	CF ₃	NHC(=0)CH,Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	8	CF ₃	NHC(=O)CF,
Me Me	Mo Me	H	H	0	H	H	8	CF ₃	NHEO, Me
Me	Me Me	H	Ħ	0		H H	8 8	CF ₈	NHSO,Ph
Me	Me	H	H	o		田田	8	CF ₃	NHSO ₂ CHF ₂
Me	Me	H	H	0		H	8	CF ₈	NHSO,CP,
1972	WE	172	T.	שו	13	п	lo,	CF ₃	NHMe ·

[0112]

【表71】

(81)

特開2002-308857

						,			
		159							160
Ri	R ²	\mathbb{R}^3	R	n	R ⁸	R ^o	Z ³	R ³¹	R ³⁸
Me	Me	Ħ	H	ō		H	8	CF ₈	NHPh
Me	Me	Н	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(≂0)Me
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Mo)C(=O)Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₈	N(Me)C(=0)CH ₂ Ph
Me	Me	H	H	0	H	H	S	CF ₃	N(Me)C(=0)CF ₈
Mo	Mo	H	H	0	Ħ	H	8	CL ³	N(Me)SO ₃ Me
Me	Me	H	H	0	H	H	s	CF ₈	N(Me)SO₂Ph
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	8	CF ₃	N(Mo)SO2CHF2
Me	Me	H	H	0	н	11	S	CF ₃	N(Me)SO ₂ CF ₂
Me	Me	H	H	0	H	H	ន	CF ₈	N(Mo)2
Me	Me	H	Н	0	H	H	ន	CF ₀	N(Me)Ph
Me	Me	H	H	0		H	ន	CF _B	Me
Me	Me	H		0		Ħ	ន	CF ₈	CN
Ħ	H	丑	Н	O		Ħ	s	CIF ₃	CI
Me	H	Н	Ħ	0		H	8	CF ₈	CI
Me	H	Me	H	0		H	s	CF,	cı.
Me	Me	Me	H	0		₽ĭ	s	CF,	cı 💮
Me	Me	H	H	0		H	S	CF ₈	CI
Me	Me	H	H	1	Ext	H	ន	CF ₂	a
Me	Me	H	H	0	Pr-i	H	s	CF ₃	CI.
Me	Mo	H	H	0		Me	s	CF ₈	CI
Me	Et	H	H	0		H	ន	CF ₃	CI.
Et	Et	H	H	0		H	S	CF _s	CI.
Me	Prei	H	H			H	s	CF ₃	CI I
Me	Pr	H	Ħ			H	S	CF ₃	a
Me	Pr-c	H	H	O		H	s	CF ₂	CI .
Me	CH ₂ Pr-c			0		H	s	CF ₃	a l
-(CH ₂)	8	H	H	0	H	H	S	CF ₂	CI.
(CH)	9 *	H	H	0	Ħ	н	S	CF ₈	CI
(CH ₂)	~	н	H	0	H	H	S	CF ₈	CI
(CH ₂)		H	H	0	H	Ħ	ន	OF.	CI
H	-(CH ₂) ₃ -	_	H	0	H	A	s	CF ₈	Cı
H	-(CH ₂)		H	0	H	H	8	CF ₈	CI
H	-(CH ₂) ₅ -		H	0	H	H	S	CF,	CI
H	-(CH ₂) ₀ -		H	0	H	н	3	CF ₃	CI.

[0113]

【表72】

(82)特開2002-308857 161 R¹ Me Me Me R² Me \mathbb{R}^{38} R^{34} Ra H H R⁶ H H H R^c 用 H H 2 2 2 ପଷଷ Me Et Me H NMe Me Ħ NMe Me Me H H NMe CI CF3 H H CF_s Me Me 2 H NMe H H H H Me Me Me 2 NMe CF, H H R Мe H H Me 2 H H NMe OCHF₈ Me Me H H 2 H NMe OCHF₂ H Me Me Me H H H 2 2 H C(=0)Me C(=0)Me H Me Me NMe H Me NMe H Me Me H H 2 H NMe H -(CH₂)8-H H Μø Me 2 H NMe -(CH₂)₄-H Me Me Н H 2 H NEt CI H Ме Me Me H H 2 NEL CF_a H Ħ H Ħ Me Me Ħ 2 NEL CF₅ Me H H H Me H NEt OCHP, н Me 2 H H Мe F Ħ NEt OCHP, Me Me 2 H Ħ Me Me Ħ H NEt 2 H Ħ -{CH²}*-Me Me H Ħ 2 H NEt H -(CH₂)₄-Ħ Me Μo H 2 Ħ H NPr-i Me H H 2 H NPr-i CF₅ H Me Me H Mo Me H Ħ 2 H NPr-i CF₈ Me H H Me H H 2 H H NPr-i OCHF₂ Mo Me Me H H Ħ H NPr-i OCHF. Me Me Me H H 2 Ħ H NPr-i -(CH₂)8-Me Мe H H 2 Ħ H NPr-i -(CH₂)₄-Me H Ме H H 2 Ħ NPr Me H CF, Me 2 Me 13 H H NPr Me Me H Ħ 2 H NPt CF, Μe H Me Ħ H 2 H H NPr OCHF. Ħ Me

[0114] 40 【表73】

H

H

Н

H

Ħ

H

Ħ

2

2 H

2

2 H H NBu-t

2

2

2

H

H

H

H H

H

H

H

H

H

NPr

NPr

NPr

NBu-t

NBu-t

NBu-t

OCHF.

CF8

OCHE,

Me

Иe

H

Me

-{CH2}3-

-(CH₉)₄-

H

Ħ

H

H

Ħ

Ħ

Me

(83)

163

特闘2002-308857

R	RS	\mathbb{R}^{2}	R4	n	R ⁸	\mathbb{R}^{8}	Z ⁴	R ²⁰	R ³⁴
Me	Me	H	H	2	H	H	NBu-t	OCHF,	Me
Me	Me	н	н	2	H		NBu-t		To)sr
Me	Me	В	H	2	H	_	NBu-t		12)4-
Me	Me	H	H	2	Н	н	NCEL-Ph	ci (°	Me
Me	Me	H	11	2	H	н	NCH ₂ Ph	CF ₃	Ħ
Me	Me	Ħ	Ħ	2	H	Ħ	NCH ₂ Ph	OCHF,	H
Me	Mo	H	. H	2	H	H	NCH ₂ OMe	CI	Me
Me	Me	H	. H	2	H	H	NCH ₂ OMe	CF _s	H
Me	Ma	H	Ħ	2	11	H	NCH ₂ OMe	OCHF.	Ħ
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH2C≡CH	Cl	Me
	Me		H		H				H
Me		H	_	2			NCH ₂ C≡CH	CF ₃	
Me	Me	H	H	2	H		NCH2C = CH	OCHT ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH2CH=CH2	CI	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH2CH=CH2	CF.	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCH2CH=CH2	OCFIF ₂	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	CI	Me
Me	Me	Ħ	H	2	H		NCHF ₂	CF ₉	H
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	NCHF ₂	CP _a	Me
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	NCHF ₂	OCHP,	H
Me	Me	Ħ	H	2	H		NCHF ₂	OCHP ₂	Me
Me	Mo	Ħ	H	2	H	H	NCHF ₃	C(=O)Me	H
Me	Mo	H	H	2	H	Ħ	NCHF ₂	C(=0)Me	Mo
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂	-(01	I ₂) ₃ .
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF _B	-(C)	H ₂) ₄ •
Me	Mo	Ħ	丑	2	Ħ		NPh	OMe	Me
Me	Me	H	H	2	H		NPb	OEt	Me Me
Me	M⊎	H	H	2	H		NPh	OCHF ₂	
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	NPb	OCH ₂ CP ₃	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	CF ₈	H
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH2CH=CH2	Mo
Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	OCH ₂ C=CH	Me
Me Mo	Me Me	H	H	2 2	H	H	NPh N(2-CDPh	C1	Me Ma
Me	Me	ᇤ	H	2	н	H	N(2-F)Ph	ci	Me
Мө	Me	H	H	2	H	丑	N(2-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	14	2	H	H	N(2-Ms)Ph	CI	Me
Me	Me Me	H	H	2 2	H	H	N(3-Cl)Ph N(3-F)Ph	CI CI	Me Me
Me	Me	Ħ	н	2	H	Ħ	N(3-OMe)Ph	Cl	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	N(8-Me)Pb	(CI	Me
Mo Me	Mo Me	H	H	2 2	H	H	N(4-Cl)Ph N(4-F)Ph	a a	Me Me
Me	Me	H	#	2	H	H	N(4-OMe)Ph	Ci.	Me
Me	Mo	H	Ħ	2	H	H	N(4-Me)Ph	ci	Me

[0115]

【表74】

165

166

<u> </u>		20.		_					100
\mathbb{R}^2	R ³	R	R*	n	R6	Re	Z	R ²⁰	R ₂₄
Me	Me €	H	H	2	H	H	N(Thiophen-2-yD	CI	Me
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	N(Thiophen-2-yl)	CF ₃	H
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	N(Thiophen-2-yl)	OCHF ₂	н
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)Me	CI	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)Me	CF ₃	н
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	NC(=0)Me	OCHP,	H
Me	Me	H	Ħ	2	H	Ħ	NC(=0)CF ₈	CI	Me
Me	Me	H	H	2	H	н	NC(=0)CF ₈	CF,	H
Me	Me	н	Ħ	2	Ħ	н	NC(=0)CF ₀	OCHF,	н
Me	Me	H	н	2	B	н	NC(=O)CH _B Ph	CI.	Me
Me	Me	H	н	2	Fí	н	NC(=0)CH ₀ Ph	CP ₂	13
Me	Me	н	H	2	H	H	NO(=0)CH ₀ Ph	OCHF,	R
Me	Me	H	H	2	H		NC(=0)Ph	CI	Me
Me	Bie	H	H	2	H		NC(=0)Pb	CP,	H
Me	Me	н	H	2	H		NC(=0)Pb	OCHP.	H
Me	Me	Ħ	H	2	Н		NC(=0)OMs	CI	Me
Me	Me	H	н	2	H		NC(=0)OMe	CF ₃	H
Me	Mo	н	H	2	H		NC(=0)OMe		H
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=O)OCH _a Ph	C)	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OCH _a Ph	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H		NC(=0)OCH ₂ Ph	OCHF ₂	Н
Me Me	Mo Me	H	H	2	H		NC(=0)OPh	CI CT	Me H
				_	H	H	NC(=0)OPh	CF ₃	
Me	Me	H	H	2	H	H	NC(=0)OPh	OCHF2	H
Me	Me Me	H	H	2 2	H	H	NC(=0)NHMe	CI CI	Me
				. –	H		NC(=O)NHM+	CF ₃	H
Me	Me	H	H	2	H		NC(=O)NHMe		H
Me	Me	13	H	2	Ħ	H	NC(=0)N(Me)2	CI	Me
Me	Me	Н	H	2	H	H	NC(=0)N(Me)2	CF ₈	H
Ме	Me	R	H	2	H	H	NC(=O)N(Me) ₂	OCHF ₂	H
H	Ħ	R	H	2	H	Ħ	NPh	OI .	Me
Me	H	H	Ħ	2	H		NFh	CI	Me
Me Me	H Me	Me H	H	2 2	H Mo	H	NPh NPh	C1 C1	Me Me
Me	Me	H	14	2	Et	H	NPh	CI CI	Mo
Me	Me	H	H	2	Pri	H	NPA	Cl	Me
Me	Me	Ħ	H	2	Me		NPh	C1	Me
Me	Et	H	H	2	H	H	NPh	CI	Ma
Et Me	Et Pr-i	H	H	2	H	H	NPh NPh	C1 C1	Mo
Me	Pr	H	H	2	H		NPh NPh	CI CI	Me Me
Me	Pr-c	H	H	2	H		NPh	Č	Me
	CH _g Pr-c		H	2	H		NPb	CI	Me
1	CH ₂) ₂ -	H	H	2	н		NPb	CI.	Me
۱,٠	CH ₂)&	н	H	2	H	H	NPh	CI	Me
	2/6			L <u>-</u>			1 - 0 of	<u> </u>	Jan. 1

[0116]

【表75】

(85)

167

特闘2002-308857

R ³	R ²	Ra	R4	n	$\mathbb{R}^{\mathfrak{d}}$	\mathbb{R}^6	24	R ²³	R ³⁴
-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	H	Ħ	NPh	Cl	Me
-(0	CH ₂)5-	Ħ	H	2	Ħ.	H	NPh	Cì	Me
H	-(CH ₂)8-	Ħ	2	H	H	NPh	Cl	Me
н	-(CH ₂	4-	H	2	H	Н	NPh	CI	Me
H	-⟨CH₂		H	2	н	H	NPh	CI	Me
H	-(CH ₂		Ħ	2	н	H	NPh	Cl Me	
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	0	Ħ	Me
Me	Me	Ħ	H	2	H	Ħ	<u>o</u>	Ca	Me
Me Me	Me Me	H	H. H	2	H	H	s s	H	Me Me
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	NMo	а а	H
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	NMe	la l	Me
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	NMe	CI	Bt
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	CI	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	CF ₃	н
Me	Me	H	H	1	H		NMe	CF ₈	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMo	OCHP,	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	OCHF,	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	C(=0)Me	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe	C(=O)Me	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NMe		H ₂) ₃ .
Me	Me	H	H	1	H		NMe		H ₂) ₄ ,
Me	Me Me	H	H	1	H		NEt	CI CF ₂	Me H
Me				1	H		NEt		n Me
Me	Me	H	H	1	H	1	NEt	CF ₃	
Me	Me	H	H	1	H		NEt	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	3	H	H	NEt	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt		H ₂) ₈ -
Me	Me	H	H	1	H	H	NEt	-(C)	12)~
Me	Me	H	H	1	Ħ		NPr-i	CI	Me
Me	Me	H	H	1	H		NPr-i	CF,	H
Me	Me	H	H	1	H		NPr-i	CF,	Me
Me	Me	H	H	1	H		NPr-i	OCHF,	н
Me	Me	Ħ	H	1	H		NPri	OCHP ₂	Me
Me	Me	Ħ	H ·	1	H	H	NPr-i		H ²⁾³ -
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr-i	-(C)	H ₂)4-
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	CI	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	CF ₈	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	CF,	Me
Me	Me	Ħ	Ħ	1	H		NPr	OCHF,	H
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	NPr	OCHF,	Me
Me	Mo	H	H	1	H		NPE		H ₉) ₇ -
Me	Me	H	H	1	H	H	NPr	-(C	H)4-

[0117]

【表76】

(86)

特闘2002-308857

		169	1				,		170
R ¹	R ²	Ra	R ⁴	_	R ⁵	R ³	24	R ⁸³	R ²⁴
Me	Me	뜌	H	n 1	H	H	NBu-t	CI	Me
Me	Me	H	н	i	H	Ħ	NBu-¢		H
Me	Me	Ħ	Ħ	1	Н	н	NBu-t	CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NBu-t		H
Me	Me	H	H	1	19	H	NBu-t	OCHF ₈	Me
Me	Me	H	H	_ '	13	H	NBu-t		
				1	13				12)8-
Me	Me	H	H	1		H	NBu-t	CI -(UI	I ₂)4-
Me	Me	Ħ	H	1	H		NCH ₁ Ph		Me
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	NCH₂Ph	CF,	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH₂Ph	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ OMe	Ci .	Ме
Me	Me	H	H	1	H		NCH ₂ OMe	CF ₅	H
Me	Me	H	H	1	H		NCH ₂ OMe	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	,	NCH2C≖CH	Cı	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ C≡CH	CF ₈	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH ₂ C≡CH	ochf,	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH₂CH=CH₂	CI CI	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	NCH _g CH=CH _g	CF ₈	н
Me	Me	H	H	1	н	Ħ	NCH ₂ CH=CH ₂	OCHP,	H
Me	Me	Я	H	1	H	H	NCHF ₂	CI	Me
Me	Me	H	H	1	H		NCHF,	CF _a	H
Me	Me	н	н	1	н	H	NCHF.	CF ₂	Me
Me	Me	н	H	1	Ħ	H	NCHT ₂	OCHF.	н
Me	Me	B	H	1	Ħ		NCHF ₂	OCHF ₂	Me
Me	Me	R	H	1	Ħ		NCHF ₂	C(=O)Me	H
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	NCHF.	C(=0)Me	Me
Me	Me	н	н	1	H	Ħ	NCHF _s		15)3.
Me	Me	н	H	1	Ħ	H	NCHF.		H ₂) ₄ -
Me	Me	н	H	1	Ħ	H	NPh	OMe	Mo
Me	Me	H	H	ì	H	H	NPh	OEt	Me
Me	Me	H	H	1	H	R	NPh	OCHF,	Me
Me	Me	H	H	1	H	A	NPh	OCH ₂ CF ₃	Me
Me	Me	H	H	1 1	H	H	NPh	Cr,	H
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	NPh	OCH2CH=CH2	
Me	Me	H	H	1	H	H	NPh	OCH2C≡CH	Me
Me	Me	H	H	1 1	H	H	NPh	CI CI	Me Me
Me	Me Me	H	H	li	Н	H	N(2-CI)Ph N(2-F)Pb	a	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	N(2-OMe)Ph	CI	Me
Mc	Me	H	H	1	H	H	N(2-Me)Ph	CI.	Me
Me Me	Me	H	H	1 1	H	H	N(2-C1)Ph N(2-F)Ph	CI	Me Me
Me	Me	H	H		H	н	N(3-OMe)Ph	a	Me

[0118]

【表?7】

(87)

171

特闘2002-308857

	172				
K83	R34				
	Mo				
	Me	i			
	Me				

\mathbb{R}^1	R2	Rª	R4	n	R	R ⁶	Z ⁴	K ⁸³	R34
Me	Me	H	H	1	H	H	N(S-Me)Ph	Ci	Mo
Me	Me	H	H	1	H	H	N(4-CI)Ph	CI.	Me
Me	Me Mo	H	H H	1	H	田田	N(4-F)Ph	OI CI	Me
Me	Me	유	H	i	Н	H	N(4-OMe)Ph N(4-Me)Ph	Ci	Me Me
Me	Me	Ħ	Ĥ	i	Ħ		N(Thiophen-2-yl)		Me
Me	34e	Ħ	H	1	H		N(Thiophen-2-yl)		H
Me	Me	H	н	ı	H		N(Thiophen-2-yl)		н
Me	Ma	H	H	1	H	н	NC(=O)Me	Cl	Me
Me	Me	Ħ	н	1	H	H	NC(=O)Me		H
Me	Me	H	H	1	н	EI	NC(=0)Me	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	NC(=0)CF ₃	Cl	Me
Me	Me	FI	FI	1	н	H	NC(=0)CF ₃	CF ₂	н
Me	Me	H	H	1	H		NC(=0)CF ₈	OCHF,	н
Me	Me	н	н	1	H	H	NC(=0)CH _B Ph	CI.	Me
Me	Me	н	H	ï	н		NC(=0)CH _s Ph	CF.	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=0)CH ₂ Ph	OCHF.	H
Me	Me	R	H	ì	ਜ	H	NC(=O)Ph	CI	Мо
Me	Me	H	Ĥ	ì	H	H	NC(=O)Ph	CP _k	H
Me	Me	н	H	1	н	H	NC(=O)Pb	OCHF.	14
Me	Me	H	H	1	н	н	NC(=0)OMe	Cl	Me
Me	Me	Н	H	1	н	R	NC(=0)OMe		H
Me	Me	H	H	ı	Ħ		NC(=0)OMe	OCHP ₂	н
Me	Me	H	H	1	н	H	NC(=0)OCH ₂ Ph	CI	Me
Me	Me	H	14	1	H	H	NC(=0)OCH2Ph	CF ₈	Ħ
Me	Me	H	н	1	н	Я	NC(=0)OCH ₂ Ph	OCHF,	H
Me	Mo	H	H	1	н	н	NC(=O)OPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	1	H	н	NC(=0)OPb	CF ₈	н
Me	Me	H	H	1	ĸ	H	NC(=0)OPb	OCHF ₂	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=0)NHMe		Мө
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	NC(=0)NHMe	CF ₈	H
Me	Me	H	H	1	H		NC(=0)NHMe	OCHF2	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=0)N(Me) ₂	CI	Me
Me	Me	H	H	1	H	И	NC(=O)N(Me) ₂	CF _s	H
Me	Me	H	H	1	H	H	NC(=0)N(Me) ₂	OCHF ₂	H
H	Ħ	Ħ	H	1	H		NPh	Cl	Mo
Me Me	H	H Me	H	1	H	H	NPh	a a	Me Me
Me	Mo	H	H	1	Me	H	NPh NPh	a	Me
Me	Me	Ħ	H	î	Et	H	NPh	či	Me
Me	Me	H	H	1	Pr i	H	NPh	CI	Me
Me	Me	H	. н	1	Me	Me	NPh	CI	Me
Me	Et Et	H	田田田	1	H	H	NPh NPh	CI CI	Me Me
Mo	Pri	표	#	ì	H	H	NPh	ci	Me
IATO	II-I	П	<u> </u>	<u>_</u> _	П		MALEI	lc1	J. PRO

[0119]

[表78]

(88)

特闘2002-308857

			1

R1	R ²	R8	\mathbb{R}^{d}	R	$\mathbb{R}^{\mathbb{L}}$	R [€]	Z ⁴	Res	R ⁹⁴
Me	Pr	Ħ	H	l	H		NPb	CI	Me
Me	Pr-c	H	H	1	H	14	NPb	CI	Me
	CH _s Pr-c		H	1	H		NPh	Cl	Me
-(0	CH ₂) ₂ -	H	H	1	H	H	NPh	Cl	Me
	CH ₂) ₈ -	H	H	1	Ħ	Н	NPh	C1	Me
-(0	CH ₂),	H	H	1	H	Ħ	NPh	Cı	Me
-(CH ₂)6.	H	H	1	н	H	NPh	CI .	Me
H	-(CH ₂)3-	н	1	H	H	NPh	CI	Me
H	-(CH2		Ħ	1	н	Ħ	NPh	cı	Me
Ħ	-{CH ₂) ₅ -	H	1	H	H	NPh	cı	Me
Ħ	-(CH ₂		H	1	н	Ħ	NPh	cı	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	o	H	Ma
Me	Me	H	H	1	H	H	þ	CI.	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	s	H	Me
Me	Me	H	H	1	H		8	CI	Me
Me Me	Me	H	H	0	H		NMe	CI	H
Me	Me	H	H	0	H		NMe. NMe	C1 C1	Me Et
Me	Me	H	H	ŏ	н		NMe	CI	CF.
Me	Me	H	H	ŏ	н	:	NMe	CF,	H.
Me	Me	H	H	0	н		NMe	CF _s	Me
Me	Me	H		1				-	
			H	0	H		NMe	OCHF:	H
Me	Me	H	H	0	H		NMe	OCHP:	Me
Me Me	Me Me	H	田田	0	H	Ħ	NMe NMe	C(=0)Me C(=0)Me	H Me
Me	Me	H	H	0	H				H*)4.
Me	Me	H	н	0	H		NMe		
Me	Me	H	H	٥	H		NEt	C1	H.)
Me	Me	H	H	o	H		NEt	CF ₃	Me H
Me	Me	H	H	0	H	H	NEt	CF ₃	Me
Me	Me	н	H	0	H		NE	OCHE:	H
Me	Me	н	н	0	H	1	NEt	OCHE ₂	Me
Me	Me	н	н	0	H		NE		R ₂) ₉ -
Me	Me	H	н	0	H		NE		H ₂) ₆ -
Me	Me	H	H	0	H		NPr-i	<u> </u>	Me
Me	Me	н	H	ŏ	H		NPr-i	CP ₅	H
Me	Me	н	Н	0	H	1	NPr-i	CF _a	Me
Me	Me	П	Ħ	0	H	1 1	NPr-i	OCHF,	H
Me	Me	H	H	o	H		NPr-i	OCHP,	Me
Me	Me	H	H	o	H		NPr-i		H ₂) ₃ -
Me	Me	H	н	0	H	H	NPr-i		H ₂)4.
Me	Mo	H	Ħ	0	H		NPr	CI	Me
Me	Me	H	H	ŏ	H		NPr	CF,	H
			L	L					

[0120]

【表79】

(89)

175

特闘2002-308857

<u></u>	72.9	±7.		-	A.Y	26	64	R ²⁸	R ³⁴
R¹ Mo	R ² Me	R ³	R ⁴	n	R ^b	R ⁶	NPr	CP,	Me R**
Me	Me	Н	Н	0	H		NPr	OCEF2	H Fre
Me	Me	11	H	0	H	H	NPr	OCHP ₂	Me
Me	Me	13	H	0	H	H	NPr		i ₂) ₂ .
Me	Me	H	H	0	H	H	NPr		1 ⁵) ⁴ .
Me	Me	H	H	0	H	H	NBu-t	CI	Me
Me	Me	H	H	ŏ	H	H	NBu-t	CF _a	н
Me	Me	H	н	0	н	H	NBu-ŧ	CF _a	Me
Me	Me	Ħ	H	0	H	Ħ	NBu-t	OCHF ₂	н
Me	Me	H	H	0	14	Ħ	NBu-t	OCRF2	Me .
Me	Me	Ħ	Ħ	0	H	H	NBu-t		I ₂) ₃ -
Me	Me	H	Ħ	0	H	н	NBu-t	-(CI	l)e
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ Ph	Cl	Me
Me	Me	H	Ħ	0	H	珙	NCH ₃ Ph	CF ₃	a
Me	Me	H	H	٥	Ħ	H	NCH₂Fh	OCHF ₂	H
Me	bde	H	H	0	H	H	NCH _z OMe	CI	Mo
Me	Me	H	H	0	H	H	NCH ₂ OMe	CF ₈	H
Me	Me	H	H	0	H		NCH ₂ OMe	OCHP ₃	Н
Ме	Me	Ħ	H	0	H		NCH ₂ C≅CH	CI	Мө
Me	Me	H	H	0	Н		NCH2C≡CH	CP ₃	н
Me	Me	H	H	0	H		NCH ₈ C=CH	OCHF ₂	H
Me	Mo	H	H	٥	H		NCH ₂ CH=CH ₂	C	Мө
Me	Me	И	H	0	H		NCH2CH=CH2	CF ₃	Ħ
Me	Me	Ħ	H	Ð	H	H	NCH ₂ CH=CH ₂	OCHF ₂	H
Me	Mo	Ħ	H	0	H		NCHIF ₂	CI	Me
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	NCHF ₂	CF ₃	H
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	NCHF ₈	CF ₃	Me
Me	Me	н	H	0	H		NCHF ₂	OCHII2	H
Me	Me	H	H	0	H		NCHF ₂	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H		NCHF,	C(=0)Me	H Ye
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	C(=0)Me	Me
Me	Me	H	H H	0	H	H	NCHF ₂		H ₂) ₈ -
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	OMe -(C.)	H ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	ŏ	Ħ	H	NPh	OE ^t	Me
Me	Me	н	H	0	H	Ħ	NPh	OCHF,	Me
Me	Me	н	H	0	н	H	NPh	OCH ₂ CF ₂	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NPh	CF,	H
Me	Me	н	H	0	H	H	NPh	OCH2CH=CH2	Me
Me	Me	Н	H	0	H	H	NPh	OCH ₈ C≡CH	Me
Me	Mo	H	H	0	14	Н	NPL	CI	Me

[0121]

【表80】

(90)·

177

特闘2002-308857

470		

\mathbb{R}^1	Rž	R ⁸	R ⁴	n	Rő	Re	24	R ³³	R ³⁴
Me	Me	Ħ	H	0	Ħ	Ħ	N(2-CDPh	CI	Me
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	N(2-F)Pb	CI	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(2-OMe)Ph	CI	Me
Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	N(2-Me)Pb	CI CI	Me Me
Me	Me	H	H	ŏ	Н	H	N(3-C1)Ph N(3-F)Ph	Ci.	Me
Me	Me	B	H	o	H	H	N(3-OMe)Ph	Ċi	Me
Me	Me	Ιŧ	H	0	H	H	N(3-Me)Ph	CI	Me
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	N(4-Cl)Ph	C1	Me
Me Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-F)Ph	ପ ପ	Me Me
Me	Me	H	H	0	H	H	N(4-OMe)Ph N(4-Me)Ph	Ci	Me
Me	Mo	Ħ	Ħ	Ö	Ĥ	H			Me
Me	Me	Ħ	Ħ	0	н	H	N(Thiophen-2-yl)		н
Ме	Mo	H	Ħ	0	H	H	N(Thiophen 2-yl)	OCHF ₃	н
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	NC(=0)Me	ca ¯	Me
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	NC(=0)Me	CF ₂	H
Me	Me	H	£Y	0	Ħ	н	NC(=0)Me	OCHF ₂	н
Me	Me	H	Ħ	0	Ħ	H	NC(=0)CFa	CI	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=0)CFa	CF _a	H
Me	Me	н	H	0	H	Ħ	NC(=0)CF ₂	OCHF ₂	н
Me	Me	н	H	0	н	Ħ	NC(=0)CH ₂ Ph	CI	Mo
Me	Me	H	н	0	н	H	NC(=O)CH ₂ Ph	CF,	н
Me	Me	н	н	0	Ħ		NC(=0)CH ₂ Ph	OCHF,	н
Me	Me	Ħ	н	0	н	H	NC(=0)Ph	CI.	Me
Me	Me	H	H	0	н		NC(=O)Ph	CF,	H
Me	Me	$_{ m H}$	н	0	н	H	NC(=O)Ph	OCHF.	H
Me	Me	н	H	0	н	H	NC(=0)OMe	Cı	Me
Me	Me	н	Ħ	0	H		NC(=O)OMe	CF ₂	H
Me	Me	н	Ħ	0	н		NC(=0)0Me	OCHF,	H
Me	Me	н	Ħ	0	н	н	NC(=0)OCH ₂ Ph	ca	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=0)OCH2Ph	CF ₂	н
Me	Me	H	Ħ	Ď	н	H	NC(=0)OCH ₂ Ph	OCHF ₂	н
Me	Me	н	H	0	н	H	NC(=0)OPh	Cı	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=0)0Ph	CIF _a	H
Me	Me	H	H	0	H	5	NC(=0)0Ph	OCRE,	н
Me	Me	н	H	0	田		NC(=0)NIIMe	CI	Me
Me	Me	H	H	0	Ħ	H	NC(=0)NHMe	CF ₈	H
Me	Me	H	H	0	H	H	NC(=0)NHMe	OCHF ₂	н
Me	Me	Ħ	H	0	Ħ	H	NC(=0)N(Me)2	CI.	Me
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	NC(=0)N(Me) ₂	CF _B	H
Me	Me	H	R	0	H	R	NC(=0)N(Me)2	OCHF ₂	н
H	Ħ	H	H	0	H	H	NPh	CI	Me
Me	H	H	H	0	H	Ħ	NPh	CI	Me
Ме	H	Me	H	0	H	田	NPh	cı	Me

[0122]

【表81】

(91)

179

特闘2002-308857

\mathbb{R}^{2}	R ²	\mathbb{R}^{a}	n4	D	Rb	R	Z*	R ⁸⁸	R ³⁴
Me	Me	H	H	0	Me		NPh	CI	Me
Me	Me	Ħ	H	0	Et		NPh	Cl	Me
Me	Me	H	H	0	Pr-i		NPh	Ci	Me
Мө	Me	H	H	0	Me		NPh	CI	Me
Me	Et	Н	H	0	H		NPh	CI	Me
Et	Bt	Ħ	Ħ	0	H	H	NPh	C1	Me
Me	Pr-i	H	H	0	H	Ħ	NPh	CI	Me
Me	Pr	Ħ	Ħ	0	H		NPh	ପ୍ର	Me
Me	Pr-c	Ħ	H	0	H		NPh	CI.	Me
928	CH ₂ Pr-c		Ħ	0	H	H	NPh	(C)	Me
. ≺	CH ²)*·	H	H	0	H	Ħ	NPh	CI	Me
- ₹	CH ₂) ₈ .	H	Ħ	0	H	Ħ	NPh	C1	Me
-€	CH ₂) ₄ -	H	H	0	H	Ħ	NPb	CI.	Me
-{	CH^{5} 0-	H	H	0	H	H	NPh	[CI	Me
H	-(CH ₂) 8	H	0	H	H	NPh	CI CI	Me
日	·(CH ₂)4-	H	0	H	H	NPh	a	Me
Ħ	-(CH ₂) ₆ -	H	0	ਜ਼	H	NPh	CI CI	Me
H	-(CH ₂		H	0	H	H	NPh	CI	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	0	н Сі	Me
Me	Me	H	H	0	H		0	ici -	Me
Me	Me	Ħ	H	Ð	H		8	lH .	Me
Me	Mo	H	H	0	H	H	ន	CI	Me
Me	Et ·	Ħ	Ħ	2	H	Ħ	NH	H	H

[0123]

【表82】

181

(92)

特闘2002-308857

182

	·	R1	R ² H	S.R.	`S(O	R S	R35	₂ B\$		
R ¹	R ²	\mathbb{R}^3	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶		Z ^{\$}	R ³⁵	R ³⁶
Me	Mo	H	H	2	H	_	NMe		H	OMe
Me	Me	Н	Ħ	2	Н		NMe		H	OBt
Me	Mo	н	H	2	H		NMe		H	OCHIF ₂
Me	Mo	Н	H	2	H		NMc		H	OCH ₂ CF ₃
Мо	Me	Н	H	2	H		NMe			H ₂) ₃ _
Me	Me	H	H	2	H		NMe			H ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	2	Ħ		NEI			H ₂) ₃₋
M¢	Me	H	H	2	H		NE		-(C	H ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	2	H		NPt-i			H ₂) _{3.}
Me	Me	H	H	2	H		NPr-i		(C	H ₂) ₄ -
Me	Me	Đ	Ħ	2	H		NCHF ₂		-(C	H ₂) ₃ .
Me	Me	H	H	2	H	H	NCHF ₂		-(C	H ₂) ₄ -
Me	Me	H	н	2	H	H		N(CH ₂		H
Me	Mo	A	H	2	Ħ	H		N(CH ₂)]H
Me	Me	H	H	2	н	H		N(CH		H
Me	Me	H	H	2	Н	H		N(CH	ปรา	Н .
Me	Mc	H	H	2	ĸ		NPh		H	OMe
Me	Mo	H	H	2	H		NPh		H	OEt
Me	Me	H	H	2	н		NPh		Н	OCHF ₂
Me	Mc	H	H	2	H		NPh		Н	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	H	Н	2	H		0		Me	H
Mc	Me	H	H	2	H		S		Mc	Н
H	H	H	H	2	H		NPb		H	OMe
Me Me	H	H Me	H H	2 2	H		NPh NPh		H H	OEt OMe
Me	Me	H	H	2	Me		NPh		H H	OEst
Me	Me	H	Н	2	E3		NPh		н	OMe
Mo	Me	H	И	2	Pr-i		NPh		н	OEt
Me	Me	H	Ħ	2			NPh		н	OMe
Me	Et	H	H	2	H	H	NPb		H	OEL
Et	Eı	H	H	2	H		NPb		н	OMe
Me	Pr-i	B	H	2	H		NPh		H .	OEt
Me	Pr	H	H	2	H		NPb		н	OMe ON:
Me	Pr-c	H	H	2	H		NPh		H	OEt
Me	CH ₂ Pr-c	ł	H	2	H		NPh		H	OMc
	.H ₂) ₂ -	H	H	2	н		NPh		A	OE:
	H ₂) ₃ -	H	H	2	H		NPh		H	OMc
	XFI2}4∙	H	H	2	H		NPh		H	OEt
-((CH ₂) ₅ -	H	H	2	H	H	NPh		H	OMe
H	-(CH ₂	}3-	H	2	Н	Ħ	NPh		H	OE t

[0124]

【表83】

(93)

183

特闘2002-308857

.

\mathbb{R}^1	R ²	R ³	R ⁴	п	RS	R ⁶	Z ^S	R ³⁵	R ³⁶
H	-(CH ₂		H	2	H		NPh	н	OMe
H	-(CH ₂)5-	И	2	H	H	NPh	H	ОМе
н	(CH ₂		H	2	Н	H	NPh	H	OBt
Mc	Mc	H	H	1	H	Н	NMe	B	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H		B	OEt
Me	Me	H	H	1	H		NMe	Ħ	OCHF ₂
Mc	Mc	H	H	1	H		NMc	H	OCH ₂ CF ₃
Mc	Mic	H	H	1	H		NMe		Fl ₂) ₃₋
Me	Me	H	Ħ	1	H		NMe	-{C	H ₂) ₄ -
Me	Mo	H	H	1	H		NEA		fl ₂) _{}-}
Me	Mis	H	H	1	Ħ	H	NBr		H ₂) ₄ -
Me	Me	H	Ħ	1	H		NPr-i		H ₂) _{3.}
Me	Me	H	Н	1	H		NPr•i	√CI	H ₂) ₄ -
Me	Me	H	H	1	H		NCHF ₂	√ C	H ₂) ₃₋
Me	Me	H	Ħ	1	H	Ħ	NCHF ₂	-(CI	H ₂) ₄ -
Me	Me	Н	Н	1	H	H	N(CH ₂)	₃ O-	Н
Me	Me	Н	н	1	н	Ħ	N(CH ₂)		н
Me	Me	H	Ħ	1	Ħ	Н	N(CH	1)4"	н
Me	Me	H	Н	1	H	H	N(CH		R
Me	Me	н	H	1	H	н		H	OMe
Me	Ме	H	H	1	H			H	OR
Mo	Me	H	H	1	K	П		H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	1	K	Н	NPh	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	A	H	1	Ħ	H	0	Me	H
Me	Me	H	И	1	н		S	Me	H
H	H	H	H	1	H			H	ONe
Me	H	H	H	1	H		NPh	H	OE t
Me	H Me	Me	H	1	H		NPh	H	OM ₆
Me Me	Me	H	H	1	Me Eı		NPh NPh	H H	OP: OMe
Me	Me	H	H	1	Proj		NPh	H	OEt
Me	Me	H	H	î	Me		NPh	н	OMe
Me	Et	H	Н	i	Ħ			H	OB:
Et	E	Н	H	1	н		NPb	H	OMc
Me	Pr-J	H	Н	1	H			H	OBt
ME	Pr	H	H	1	H.		NPh	H	OMe
Me	Pr-c	Ħ	H	1	H			H	OEt
Me	CH ₂ Pr-c		H	1	H			H	OMe
	H ₂) ₂ -	H	H	1	H	H		H	OE:
	H ₂) ₃ -	H	H	1	H	H		H	OMe
	H ₂) ₄ -	H	Н	1	H	H	NPh	H	OE t
«	H ₂) ₅	H	H	1	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH₂),-	Ħ	1	H	H	NPh	H	OE:

[0125]

【表84】

(94)

特闘2002-308857

185

185

Ri	R ²	R³	R4	ם	R ⁵	R6	2 ⁵	R ³⁵	R ³⁶
H	·(CH ₂		H	1	H		NPb	H	OMe
H	-(CH ₂		н	1	H	H	NPh	H	ОМе
H	-(CH ₂		Н	1	H	Н	NPa	н	OE t
Me	Me	H	H	0	H	Н	NMe	H	OMe
Me	Me	H	Ħ	O	H		NMe	H	OBI
Me	Me	H.	H	O	H		NMc	H	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	н		NMc	H	OCH ₂ CF ₃
Me	Me	Ħ	H	0	H		NMe		H ₂) ₂ .
Me	Mo	H	H	0	H		NMe	-{C	H ₂)4-
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	NEt	√ C	H ₂) ₃ .
Mo	Me	H	H	0	H	Н	NEt		H ₂) ₄ .
Me	Me	H	Ħ	0	H	ਸ	NPc-i	₹0	H ₂) _{3.}
Me	Me	H	Н	0	H	H	NPr-i	-(C	H ₂) ₄ -
Me	Me	H	Ħ	0	H	H	NCHF ₂		H ₂) ₃ _
Me	Mc	H	H	0	н	Н	NCHI'2		H ₂) _s .
Me	Me	н	Н	0	Ħ	Ħ	N(CH		H
Me	Me	н	H	0	H	H	N(CH		H
Me	Me	н	н	0	H	H	N(CI	(2)00	H
Me	Mc	H	н	0	Ħ	H	N(C		H
Mo	Me	Н	H	0	Н		NPh	H	OMe
Mo	Mo	н	Ħ	0	H		NPa	EI	OEs
Mo	Mo	н	H	0	H	H	NPh	H	OCHF ₂
Me	Me	H	н	0	Ħ	Н	NPh	EI	OCH ₂ CF ₂
Me	Me	н	H	0	Ħ	H	0	Me	म
Mc	Mc	н	H	0	Ħ	Ħ	S	Me	H
H	H	Н	H	0	H	H	NPh	H	OM¢
Me	Н	H	H	0	H		NPh	H	OB
Mc	H	Me		0	H		NPh	H	OMe ,
Me	Me	H	H	0	Me		NPh	H	OB
Me Me	Me	H H	H	0	Et Pr-		nph nph	H	OM: OB:
Me	Me	Н	H	0			NPb	H	OMe
Me	E	H	H	ŏ	H	Н		Ħ	OEt
E	E	н	H	ŏ	H	Н	NPb	H .	OMe
Me	Pr-i	Н	H	0	H		NPb	н	OE t
Me	Px	H	H	0	H		nph	H	OMe
Me	Рт-с	H	H	0	H		NPA	H	OEt
	CH2Pr-c		H	9	H	H		н	OMe
	H ₂) ₂ -	H	H	0	Н	H	NPh	Н	OEt
-(0	H ₂) ₃ .	H	H	0	H	H	NP6	Ħ	ОМо
-(0	H ₂)4-	H	Ħ	0	H	Ħ	NPb	н	OEt
-(0	H ₂) ₅ -	H	H	0	Ħ	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂) , -	н	0	H	H	NPh	н	OEt

[0126]

40【表85】

R ¹	R ²	R ³	R4	n	RS	R ⁶	Z ^s	R ²⁹	R ³⁶
H	-{CH ₂)4-	H	0	H	Н	NPh	H	OMe
A	·(CH ₂)5-	H	0	H	H	NPh	H	OMe
H	-(CH ₂)s•	Ð	0	H	H	NPh	H	OE t
Me	Et	H	H	2	H	H	0	H	H
Mc	- Et	H	H	2	H	H	S	H	н
Mo	Et	H	H	2	H	H	NH	H	H

[0127]

【表86】

(95)

187

特闘2002-308857

188

	$\mathbb{R}^{1} \xrightarrow{\mathbb{R}^{2}} \mathbb{R}^{3} \mathbb{R}^{4}$												
				•	N	<u>_</u>	9(O) 5 C R40)					
							R° P87 (O)						
\mathbb{R}^1	Rº	R3	\mathbb{R}^4	n	R	\mathbb{R}^6	R ⁸⁷	R ⁸⁸	R ³⁹	R ⁴⁰			
Me	Mo	H	H	2	H	H	H	H	H	H			
Mo	Me	H	H	2	H	H	H	H	H	H	N-oxide		
Mo	Me Me	H	H	2	H	H	Cl	Ph Ph	H	H	•		
Me Me	Me	H H	H	2 2	H	H	OMe Cl	Me Me	H	H			
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	Me	H	Ħ			
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	H	CF ₃	H	H			
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	H	CF ₃	H	H	N-oxide		
Me	Me	H	H	2	H	H	CI	CF ₃	Н	H			
Me	Me	H	H	2	H	н	CN	CF ₃	Ħ	H	-		
Me	Me	H	H	2	H	H	OMe	CF ₃	H	H	-		
Me	Me	H	H	2	H	H	OEt	CF ₈	H	Ħ	-		
Me	Mo	H	H	2	H	H	Me	Me	H	Н	N-oxide		
Me	Me	H	H	2	H	五	Ph	Ph	H	Н	•		
Me Me	Me Me	H	H	2	H	H	Cl Cl	(4-CI)Ph (4-CI)Ph	H	Me H			
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	OMe	Cl	H	H	:		
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	Cl	(CH ₂)		H	-		
Me	Me	Н	H	2	H	H	Me	(CH ₂)		H			
Me	Me	H	H	2	H	H	Cl	(CH ₂)		H			
Me	Me	Ħ	H	2	Ħ	H	Ме	(CH ₂).	4	H	-		
Me	Me	Н	H	2	H	H	C1	H	(CI		-		
Me	Me	Ħ	H	2	H	H	Me	H	(CF	I ₂) ₈			
Me	Me	H	Ħ	2	H	H	CI	H		I ₂) ₄	-		
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	Ме	H	(CI	I2)4			
H	H	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	-		
Me	H	H	H	2	H	H	H	CF ₃	H	H	•]		
Me	H			2	H	H	H	CF ₃	H	Ħ	-		
Me	Me	Me	A	2	H	H	H	CF3	H	H	-		
Me	Me	H	H	2	Mc	H	H	CF _a	H	H	•		
Me	Me	H	H	2	Et	H	H	CF ₈	H	H	-		
Me	Me	H	H	2	Pr•i		H	CF ₈	H	H			
Me	Me	H	Ħ	2	Me		н	CF ₈	H	H	•		
Me	Et	Н	H	2	H	H	Н	CF ₈	H	H	-		
Et	Et	Н	H	2	Н	н	H	CF ₃	H	H			
Me	Pr-i	H	Н	2	Н	H	H	CF ₈	H	H	-		
Me	Pr	H	H	2	H	Н	H	CF ₈	H	H	•		

[0128]

【表87】

(95)

189

特開2002-308857

190

-1	-8	3	-4		-5	-8	R ^s	R ⁸⁸	89	560	
R	R ²	_	R⁴	מ	R ⁵	\mathbb{R}^6			R89	R ⁶	
Me	Pre	H	H	2	H	H	H	CF ₈	H	H	•
	CH ₂ Pr-c	H	H	2	H	H	н	CF ₅	H	H	١ ٠
	(CH ₂) ₂ -	H	H	2	H	H	H	CF ₈	H	H	-
- ((CH ₂) ₃ .	H	H	8	H	H	Ħ	CF ₈	H	H	-
1 4	CH ₂).	H	H	2	H	H	H	CF ₃	Ħ	H	
	(CH ₂) ₅ -	Ħ	Ħ	2	Ħ	H	Я	CF,	н	H	
H	-(CH ₂)	Ħ	2	H	H	н	CF.	н	н	
H	-(CR ₂		H	2	H	H	Ħ	CF,	н	H	_ [
H	(CH		H	2	K	H	Ħ	CF.	H	н	
н	(CH ₂		H	2	H	H	н	CF,	H	н	
Me		H	H	1	H	H	H	H	H	H	
Me		H		HIH		H	H	H	H	н	N-oxide
Me	Me	ä	H	i	Ħ	H	ä	Ph	H	H	-
Mo		H	H	ī	H	H	OMe	Ph	H	H	- 1
Me	Me	H	H	1	B	Æ	CI	Me	H	H	
Me	Me	H	H	1	H	H	ОМе	Me	H	H	
Me	Me	H	H	1	Æ	H	H	CP ₈	H	H	·
Ме	Me	H	Ħ	1	H	H	CI.	CF3	H	H	-
Me	Me	H	Н	1	H	H	CN	CF3	H	H	
Me	Me	H	H	1	H	H	ОМе	CF ₈	H	Ħ	-
Me	Me	П	П	1	H	Ħ	OPi	CF ₈	Н	H	-
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	Me	Н	H	N-oxide
Me	Me	H	H	1	표	H	Ph	Ph	Н	H	
Me	Me	H	H	1	H	H	ପ	(4-CI)Ph	H	Me	-
Me Me	Me Me	H	H	1	H	H	Cl OMs	(4-CI)Ph	H	H	•
Me	Me	ū	Ħ	1	H	H	CI	(CH ₂)		H	
Me	Me	Ħ	H	1	H	H	Me	(CH ₂)		H	
Me		H	H	1	H	H	C1	(CH ₂)		田田	
Me		H	B	1	H	H	Me	(CH ₂)		H	_
Me	Me	H	H	1	H	H	Cl	H		193	: I
Me	Me	H	H	ì	H	H	Me	H		-201 L ₂) ₈	l . I
Me	Me	H	H	1	H	H	CI	H		-22/R 3_2),	1
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	H		₹ ⁹)* -∞.	
H	H	н	H	1	H	H	H	CF ₃	H	H	1 . 1
Me	H	H	H	1	Ħ	H	H	CP _s	H	H	
Me	H	Me		1	H	H	H	CF ₃	H	н	[
Me	Me	Me		1	H	Н	H	CF ₃	H	H	[
Me		H	H	1	Me	4 1	H	CF ₃	Н	Н	[
Me		н	H	i	Et		н	CF ₈	H	Н	
Me	Me	Н	H	1	Pr-i		Н		ı	i .	
Me	Me	Н	Н	1		Me	1	CF ₃	H	H	
inse	p-10	11	뜨	Ľ	Ale	M 9	H	CF ₃	Ħ	H	<u> </u>

[0129]

【表88】

(97)

191

特闘2002-308857

_		<u> </u>	_				F 2			174	
\mathbb{R}^{1}	R²	\mathbb{R}^3	\mathbb{R}^4	n	${f R}^{6}$	Re	R ³⁷	R ⁹⁸	\mathbb{R}^{33}	R40	
Me	Et	H	H	1	H	Ħ	H	CF ₃	H	H	-
Et	Et	H	H	1	H	H	H	CF3	H	H	-
Me	Pr∙i	H	H	1	H	Я	H	CF ₃	H	H	-
Me	Pr	Н	H	1	H	Ħ	Н	CF:	H	H	-
Me	Pr-c	Ħ	H	1	Ħ	H	H	CF ₈	Н	H	.
Me	CH ₂ Pr-c	Ħ	ы	1	H	н	H	CF,	H	Ħ	.
	CH ₂) ₂ -	H	н	1	H	H	H	CF ₈	H	H	
	CH ₂) ₈ -	H	Н	1	H	H	H	CF _s	H	H	
	CH ₂	H	Ħ	1	н	н	H	CIF ₈	H	H	
	CH ₂) ₅ -	H	H	1	н	Н	H	OF ₃	H	н	
H	(CH,		Ħ	1	H	14	H	CF,	Ħ	н	
H			H	1	H	H	Н	CIF ₃	H	H	
H	-(CH ₂) ₆ -		H	1	н	Н	н	CF ₂	H	H	
H	-(CH ₂		H	1	H	H	H	CF ₂	H	H	
Mic	Me	H	H	0	Н	H	H	H	Н	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	H	H	H	H	N-oxide
Me	Me	H	Ħ	0	n	Ħ	Ċi	Ph	Ħ	Ħ	11-02100
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Ph	H	H	-
Me	Me	Ħ	H	0	H	H	C) Me		H	H.	
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Me	H	H	
Me	Me	H	Н	0	H	H	Ħ	CF ₃	H	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	CI.	CIF _a	H	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	CN	CF2	H	H	-
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	CF ₃	H	H	
Me	Me	H	H	0	H	H	OEt	CF ₈	H	H	-
Ме	Me	H	Н	0	H	H	Me	Me	H	H	N-oxide
Me	Me	H	H	Ð	Ħ	Ħ	Ph	Ph	H	H	•
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-CI)Ph	H	Me	-
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	(4-CDPh	H	H	•
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	Cl	H	H	•
Me	Me	H	H	0	H	H	α	(CH ₂)		H	•
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	(CH ₂)		H	•
Me	Me	H	H	0	H	H	CI	(CH ₂)		H	
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	(CH _e)		H	•
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H	(CI		-
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	H		$I_3\rangle_0$	•
Me	Me	H	H	0	H	H	Cl	H (I_8	•
Me	Me	H	H	٥	H	H			_	$I_2)_4$	•
Me	Me	H	H	0	H	H	(2-Chloropyridin-3- yl)methylthio	H	H	H	-
H	H	H	H	0	Ħ	H	H	CP,	H	Ħ	.
Mie	H	Н	H	0	Ħ	H	н	CF,	HH		
-				_	•		I				

[0130]

【表89】

(98)

特開2002-308857

						1,,,,,					
		193						194			
\mathbb{R}^1	R ²	\mathbb{R}^8	R4	n	\mathbf{R}^6	Re	₹ ⁸⁷	R ³⁸	\mathbb{R}^{89}	R40	
Me	Me	Me	H	0	H	П	H	CF ₃	H	Ħ	•
Me	H	Me	R	0	H	Ħ	H	CF ₃	H	H	•
Me	Me	H	H	0	Me	H	H	CF3	H	н	•
Me	Me	H	Ħ	0	Et	H	H	CF ₃	H	H	•
Me	Me	H	H	0	Pr-i	Ħ	H	CF ₈	Ħ	Ħ	- (
Me	Me	H	H	0	Me	Me	H	CF ₈	H	H	•
Me	Et	H	H	0	H	H	H	CF ₈	H	H	-
Et	Et.	H	H	0	Ħ	H	H	CF ₈	н	Ħ	_
Me	Me Pr-i H		H	0	П	H	H	CF ₈	Н	H	-
Me	Pr	H	H	0	Н	H	H	CF ₈	H	н	•
Me	Pr-c	H	Ħ	0	Н	H	н	CF ₃	н	Н	-
Me	CH2Pr-c	H	H	0	H	H	H	CF ₃	Ħ	H	-
7	CH ₂	H	H	0	H	H	Ħ	CF ₃	H	H	•
-{	CH ₂) ₃ -	H	H	0	H	11	H	CF ₈	H	H	-
	-(CH ₂) ₄ - H		H	0	H	H	H	CF ₃	H	H	•
	-(CH ₂) ₅ H		H	0	H	H	· H	CF ₃	H	H	-
H	-(CH ₂)3-	H	0	H	H	H	CP _a	H	H	•
Н			H	0	H	Ħ	H	CF ₈	H	Ħ	•
H			H	0	H	H	H	CF ₃	H	Ħ	-
H	H (CH2)6-				H	CF ₈	H	Ħ	-		
Me		H	H	2	H	H	H	H	H	H	•

[0131]

【表90】

(99

特闘2002-308857

					(99)				特開2
1	95								19
	$R' \xrightarrow{R^3}$		ارم) - در ارم) - در	, R''	-X-R	;•;			
R	R ²	R ²	R	ກ	Rs	R ⁶	R41	R42	R ¹⁸
Me	Mc	H	71	2	H	H	Ħ	CI.	Ci
Me	Me	н	H	2	H	н	H	OH	C1
Me	Me	H	H	2	H	н	H	OMe	CI
Me	Me	H	H	2	H	н	H H	OEt	CI CI
Me Me	Me Me	H	H	2 2	H	H II	H	OPri OPr	ä
Me	Ma	HE	H	2	H	H	Ħ	UBurt	ci
Me	Мe	н	н	2	н	н	н	OCH ₂ Pre	Ċl
Me	Me	н	H	2	H	н	Н	OCH ₂ Burc	Cl
	Me	133	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pen·c	C1
Me			i			H	H		CI
Me	Me	æ	H	2	H		H	OCH, Hex-c	CI
Me	Me Me	H	H	2	H	H	H	OHex.s Obev.c	CI
Me Me	Me	н	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	CI
Me	Me	ii l	H	2	H	H	H	OPh	CI
Me	Me	H	H	2	H	H	н	OCIU.	či
Me	Me	н	н	2	H	H	H	SH	ci
Me	Me	n	ñ	2	H	H	11	SMe	či
Me	Me	n	H	2	11	H	H	SO ₂ Me	ä
Me	Me	В	H	2	н	н	Н	SEE	C:I
Me	Mo	н	H	2	H	я	н	SO,Et	ĊĪ.
Me	Me	Ħ	H	2	ii.	H	н	SPr-i	CI
Me	Me	н	Ĥ	2	H	н	Ĥ	SO _o Pr-i	Ö
Me	Me	H	Н	2	н	н	H	SPh	CI
Me	Me	н	લ	2	Н	11	н	SC ₂ Pb	CI
Me	Me	H	H	2	Н	Ħ	н	SCHF ₂	ÇI
Me	Me	H	H	2	н	n	н	SO,CHF.	CI
	Me	ű		2	H	н	H	NH ₂	ÇI
Me Me	Me	H	H	2	Н	н	H	NHMe	CI
Me	Me	ij	н	3	H	Н) ,	NMe.	C
Me	Me	H	A	2	H	н	H	NHE	Cl
Me	Me	H	н	2	н	н	FI	NEL	CI
Mo	Me	н	H	2	и	н	Ĥ	NHPh	CI
Me	Me	н	ä	2	н	Ħ	H	N(Me)Ph	či
Me	Me	H	H	12	н	Ħ	H	CN	Cl
Me	Me	H	H	Ş	н	H	H	F	Me
Me	Me	H	H	2 2	H	H	н	C)	Me
Me	Me	H	11 13	2 3	H	H	H	OH OMe	Me Mo
Mə Me	Me Me	H	H	2	Н,	11	H	ORt	Me
Me	Me	H	H	2	H	н	Ĥ	OPri	Me
Mc	Me	H	Ĥ	2	H	Я	11	OPr	Ma
Me	Me	H	H	2	H	H	н	OBurt	Me
Μę	Me	11	н	2	н	H	H	OCH ₂ Prc	Ma
Me	Me	H	Н	2	H	H	H	OCH ₂ Bu-c	Me
				۱ ۵	**	7.0	7.7	ACIL Dance	NG.,

[0132]

【表91】

(100)

197

特闘2002-308857

198

R	R ²	R ³	R,	a	Ŗ°	R*	R41	R ^{F7}	Rrs
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen.c	Me
Me	Me	H	11	z	II	п	E2	Olfex-c	Me
Me	Me	11	13	2	Н	H	Н	ОСН₃РЬ	Me
Me	Me	ਸ	н	2	н	H	н	OPh	Mo
Me	Me	Н	H	2	Н	н	H	OCHF,	Me
Me	Me	н	н	2	H	H	н	SH	Me
Me	Me	н	н	2	Ħ	н	H	SMe	Me
Me	Me	н	н	2	Н	н	A	SOuMe	Mc
Me	Me	н	н	2	н	н	Н	SEA	Me
Me	Me	н	н	2	H	н	H	SO ₂ Et	Me
Me	Me	н	Н	2	н	H	Θ	8Pri	M⊭
Me	Me	н	н	2	н	H	H	SO ₂ Pr	Me
Me	Me	H	H	2	ਸ	н	H	SPh	Mc
Me	Me	н	H	2	Н	₹E	ы		Mo
		н						SO ₂ Ph	
Me	Me		Н	2	H	H	H	SCHF:	Me
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO₂CHF2	Me
Mo	Me	н	H	2	H	н	t-)	NH ₂	Me
Mo	Me	н	н	2	H	н	н	NHMe	Me
Me	Me	H	H	2	H	Ħ	H	NMe ₃	Me
Me	Me	н	H	2	н	н	н	NHE	l-Io
Me	Me	н	н	2	н	H.	H	NEt.	Me
Mo	Me	н	н	2	Н	н	н	NHPh	Mo
Me	Me	н	н	2	Н	Н	H	N(Me)Ph	b.Lo
Me	Mic	Ħ	H	2	н	н	н	CN	Me
Me	Me	И	H	2	H	H	H	¥	Prei
Me	Me	H	H	2	H	H	H	C1	Pri
Me	Me	H	tı	2	H	H	H	OH	Pr-i
Me	Me	H	14	2	H	H	H	OMe	Pr∗i
Mc Me	Me Me	H	H	2	H	H	I-I I-I	OEt.	Pr-i
Me	Me	н	H	2	H	H	H	OPr-i OPr	Pri Pri
Me	Me	H	H	2	Н	H	H	OBur	Pri
Me	Me	н	H	2	н	н	н	OCH ₂ Pre	Pr-i
Me	Me	Ħ	[]	43	н	म	H	-	Pr-i
								OCH ₂ Bu-¢	
Me	Me	н	Hì	7	Н	H	H	OCH Penc	Pr-i
Me	Me	Н	H	Ż	H	Н	H	OCH2Hex-c	Prri
Ma	Me	н	H	Ž	H	H	H	Oleare	Pri
Me	Me	H	H	2	[4]	H	H	OHex-c	Pr-i
Me	Me	Ħ	H	3	H	H	H	ОСН₂РЪ	Pr-i
Me	Me	II.	LL	Ż	u),	l k	OPh	Pr-i
Me	Me	Н	H	2	H	H	H	OCHF.	Pri
Me	Me	н	H	2	н	H	H	SH	Pr-i
Me	Me	н	H	2	н	H	Н	SMe	Pr-i
Me	Me	H	H	2	н	Н	н	eM ₅ O2	Pri
Me	Me	н	н	2	H	H	H	SEt.	Pr-i
Me	Me	н	H	2	н	H	H	SO ₂ Et	Prei
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SPr-i	Pri
Me	Me	H	Н	2	Н	H	H	SO ₂ Pr-i	Pri
Me	Me	н	н	2	н	표	н	SPh	Pri
Me	Me	H	H	2	H	H	H	SO₂Ph	Pri
Me	Me	H	Н	2	H	н	H	SCHP ₂	Pri
Me	Me	н	H	2	H	H	1-1	SO, CHF.	Pr−i

[0133] [長92]

(101)

199

特闘2002-308857

200

ſ	R'	R ^s	R ⁸	R ⁴	n	R ⁵	R^	R ^{1t}	R ⁴⁸	R*3
r	Me	Me	ਜ	H	2	H	Н	14	NH,	Pri
1	Me	Me	н	В	2	н	H	1-3	NHMe	Pri
1	Me	Me	н	Ħ	2	H	Н	H	NMe _t	Pri
1	Me	Me	н	H	2	11	н	H	NHEL	Pr+s
	Me	Me	H	11	2	H	н	u	NEt ₂	Pres
1	Me	Me	н	н	2	н	H	н	NHPb	Pri
ı	Mo	Me	н	Н	2 2	н	11	н	NOMORY	Peri
١	Me	Me	H	н	2	H	н	н	CN	Pri
I	Me	Me	H	н	2	H	Н	H	C1 E	Pre
1	Me Mo	Me Me]-] -	H	2 2	H	H	H	HQ (1)	Pre Pre
1	Me	Me	H	н	2 2	H	н	8	OMe	Pre
1	Me	Me	H	ë		31	н	8	OEt	Pre
1	Me	Mo	H	Ü	2	Ä	H	H	OPre	Pre
ı	Me	Me	O.	H	*	H	н	H	OPr	Pre
1	Me	Me	H	H	2	H	Ħ	H	OBu-t	Pre
I	Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	Pr-e
ı	Me	Me	В	H	2	H	Ħ	H	OCH₂Bu-c	Pre
1	Me	Мe	H	H	٤	11	H	H	OCH ₃ Pen·c	Prec
1	Me	Ме	H	H	Z	Ħ	H	н	OCH Hex to	Pr-c
1	Me	Me	H	II	Z	H	Ħ	H	OPen'c	Prc
I	Me	Me	н	н	ż	Н	Ħ	Ħ	ожено	Pre
1	Me	Me	H	H	2	Н	H	н	OCH,Ph	Prc
ı	Me	Me	H	Ħ	2	H	H	н	OPh	Pro
ļ	Мe	Me	н	11	2	н	H	H	OCHF2	Pro
١	Me	Me	Ħ	H	2	Н	Н	H	SH	Pre
	Me	Me	H	H	2	H	H	H	SMe	Pro
١	Me	Me	H	H	2	H	H	H	50 ₂ Me	Pre
	Me	Me	H	H	2	H	H	Ħ	SEL	Pre
1	Me	Me	H	H	2	H	H	H H	SO₂Et SPr-i	Pre
-	Me	Me	H	H	\$	H	H	H Tij		Pr-c
1	Me	Me Ma	H	H	Ž 2	A	H	17	SO ₂ Pri SPh	Pr-c
1	Me Me	Me Me	Н	H	2	A	Н	н	SO _t Ph	Pre
1			н	Н	2	Н	Ð	H	SCHF.	Pro
1	Me	Me		н	1 1	Н		H	SO ₂ CHF ₂	
1	Me	Me	H		2		Ð.			Pre
١	Me	Me	H	H	2	н	Ħ	H	NH ₂	Pre
1	Me	Me	H	H	2	H	A	H	NHMe	Pre
1	Me	Mc	H	H	2	H	lj D	H	NMe ₂ NHEt	Pre
١	Me	Me Me	H	H	3 2	H	A	H	NHEL.	Pro Pro
ı	Me M-	Me Me	H	H	2	H	1	H	NHPh	Pro
ı	Me Me	Me	H	H	2	Н	H	H	N(Me)Ph	Pro
ı	Mo	Me	н	Ĥ	2	H	н	H	CV.	Prc
Į	Me	Mo	н	н	2	H	н	H	F	CHF2
Į	Me	Me	H	н	2	Ħ	н	н	Cl	CHF2
1	Me	Мe	н	н	2	н	н	Ħ	он	CHF,
-	Mo	Me	н	H	2	Н	H	H	OMe	CHF.
	Me	Me	H	H	8	n	H	н	OEt	CHF
	Me	Me)1 }1	H.	2	H	H	н	OPri	CHF,
١	Me	Me	H	H	2	117	H	н	OPr	CHF,
ı						ı			1	
ı	Me	Me	н	H	2	H	14	H	QBu·t	CHF

[0134]

【表93】

(102)

201

特開2002-308857

R'	R ²	R ³	R ⁴	π	R ^s	R ⁴	R ⁴⁰	R.a.	R43
Me	Me	Ħ	Н	2	Н	Ħ	H	OCH-Pr-c	CHP,
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Burc	CHL ⁵
Me	Me	H	Н	2	H	B	H	OCH ₂ Pca-c	CHF
Me	Me	Н	H	2	H	И	H	OCH ₂ Hex-e	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	Ħ	II	H	OPenc	CHF ₂
Me	Me	H	Н	2	Н	H	H	OHexe	CHF,
Me	Me	Н	H	2	H	H	H	OCH₃₽ħ	CHT ₂
Me	Me	н	H	2	н	H	H	OPŁ	CHF ₂
Mc	Me	H	H	2	H	H	Н	ochr,	CHF:
Me	Me	H	Н	\$	H	Ш	Н	SH	CHF ₂
Me	· Ma	[4]	j-E	2	H	H	H	SMe	CHF2
Me	Mə	H	H	2	H	н	H	SO ₂ Me	CHP.
Me	Me	н	и	2	н	H	Ħ	6 8 %	CHP ₂
Me	Me	H	H	2	н	н	H	SO₂Et	CHT.
Me	Me	Н	H	Ż	H	Ħ	н	SPr-i	CHF2
Me	Me	iì	н	2	H	Ħ	H	80 ₂ Prn	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	Œ	H	SPh	CHP ₂
Me	Me	Н	H	2	H	u	H	SO ₂ Ph	CHF
Me	Me	н	F)	2	H	H	H	SCHF,	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	н	H	SO ₂ CHF ₂	CHR.
Me	Me	П	H	2	H	ਮ	H	ИHs	СКГ
Me	Me	H	H	2	H	н	H	NHMe	CHF ₂
Me	Мe	H	8	2	H	н	ы	NMe ₂	CHF2
Me	Мe	H	Ħ	2	H	H	H	NHEt	CHF ₂
Me	Me	H	Ð	2	Н	н	H	NEL	CHF.
Me	Me	Н	H	2	H	H	H	NHPh	CHF:
Me	Me	H	Ħ	2	H	н	A	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	H	2	H	H	Ð	CN	CHL*
li) o	Me	н	H	2	н	Ħ	H	F	CF;
Me	Me	H	H	2	H	H	H	C)	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	11	OH	CF ₃
Me	Me	н	H	2	H	H	Н	O.Me	CF,
Me	Me	н	H	2	Н	H	H	OEt.	CF,
Me	Мe	H	H	2	Н	H	H	OPri	CF,
Me	Me	н	H	2	И	H	н	OPr	CF,
Me	Me	н	H	2	H	н	H	OBurt	CF ₁
Me	Me	H	H.	2	H	Н	н	OGH ₂ Pr·c	CF,
Me	Ме	Н	H	2	Ħ	Н	H	OCH,Bare	CF,
Me	M€	H	H	2	H	Н	11	OCHI ₂ Pen-c	CF ₃
Me	Me	Ħ	H	2	A	H	н	OCH2Hexc	CF,
Mc	Me	H	H	2	H	H	H	OPen c	CF _p
Me	Me	H	H	2	14	H	H	Officare	CF3
Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH ₂ Ph	CF ₃
Me	Me	H	H	2	Н	Ш	H	OPh	CF ₃
Me	Me	H	н	2	H	H	H	OCHF:	CF3
Mc	Me	H	H	2	Ħ	17	Н	SH	CF3

[0135] 【表94】 (103)

203

特闘2002-308857、

R1	R ²	R	R4	n	R ³	R*	Rii	R's	R
Me	Mo	Ħ	H	Ź	H	H	Н	SMa	CF,
Me	Me	11	Н	2	н	н	н	SO ₂ Me	CF,
Me	Me	H	H	2	e	н	н	SEt	CF,
Me	Mu	H	н	2	ä	н	Ĥ	\$0,Et	CF,
Me	Me	H		2	1	π			
			H	_	D	1	П	SPr	CF ₃
Me	Me	H	H	ટ	H	H	H	SO ₂ Pri	CF,
Me	Me	H	H	2	В	H	Н	SPh	CF,
Me	Me	H	н	2	H	н	н	SO ₂ Pb	CF3
Me	Me	Ħ	н	3	н	H	Н	SCHF,	CF ₃
Me	He	H	11	2	Ħ	H	11	SO ₂ CHF ₂	CF.²
Me	· Me	H	н	2	H	н	H	NH ₂	CF₃
Me	Me	11	н	2	H	н	н	NHMe	CF ₃
Me	Me	H	H	ž	н	н	H	NMe,	CF,
Me	Me	H	H	2	H	H	н	NHE	CF,
Me	Mo	н	н	2	a	Ж	14	NE:	CP ₃
Me	Me	H	н.	2	я	H	н	NHPh	
				_					CF ₂
Me	Me	H	H	3	Н	Н	Н	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Me	н	н	Ž	H	н	н	CN	CF ₃
Me Me	Me	H	H	2	H	H	H)) Cutu	OMe
Me	Me Me	Ħ	H	2 2	H	H	H	OH OMe	OMe OMe
Me	Me	H	H	3	H	H	H	OEt	OMe
Me	Me	H	11	2	ë	H	iť	OPr-i	OMe
Me	Me	H	H	2	ä	н	Ĥ	OP3	OMe
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	H	OBu-t	Olife
Me	Me	H	н	2	H	н	н	OCH ₂ Prec	OMe
Me	Mc	H	н	2	A	н	н	OCH ₂ Burc	OMe
Me	B.Le	H	H	2	H	H	H	OCH Penc	OMe
Me	Me	H	H	2	A.	H	н	OCH Hex c	OMe
Me	Me	14	<u> </u>	2	H	Н	H	OPenc	ОМe
Me	Me	H	H	2	н	H	H	OHex-c	OMe
Me	Me	H	H	2	Ħ	H	н	OCH₂Ph	OM#
Me	Me	H	H	2	A	H	H	OPh	OMe
Me	Me	н	H	2	A	Н	ì·C	OCHF ₂	9MO
Me	Me	H	Ħ	3	B	H	ŀſ	311	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	H	5Me	OMe
Me	Me	H	Н	2	H	H	H	SO,Me	Obte
Mc	Mo	H	H	2	В	Н	H	SEL	OMe
Me	Me	H	H	2	8	H	H	SO Et	OMe
Me	Me	17	II Li	2	H	H	H	Silveri	OMe OM:
Me Me	Me Mo	H	H	2	H	H	н	SO ₂ Pr·	OMe OMe
Me	Me	H	H	2 2	8	H	H H	SPA	OMe
								SO,Ph	OMe
Me	Me	H	H	2	A	H	н	SCHF	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	н	SO,CHF,	OMe
Me	Me	H	H	2	H	H	н	NH ₂	OMe
Me	Me	H	н	2	А	H	н	NHMe	OMe
Me	Me	H	H	3	H	H	H	NMe ₂	OMe
Me	Me	H	И	2	H	H	н	NHE	OMe
Me	Mo	H	Ħ	2	H	H	Н	NEt ₂	OMe

[0136] 【表95】 (104)

205

特闘2002-308857

206

	R'	R ³	R ²	R'	13	R ⁶	RB	R€	R ⁴²	R [€]
-	Me	Me	14	14	2	H	Ħ	H	NHPh	OMe
-	Me	Mc	ĸ	14	2	H	H	H	N(Me)Ph	OMe
1	Me	Me	H	Н	2	H	H	H	CN	9MQ
1	Me	Me	н	н	2	. IT	H	H	F	DPh
١	:Me	Me	H	Н	2	H	H	H	OH	OPh
ı	Mc	Me	H	Н	2	Н	H	H	OMe	OPh
1	Me	Me	Н	Н	2	H	H	ļi	OF	OPh
١	Me	Me	H	R	2	H	H	H	Cips.	OPh
ı	Me	Me	H	HH	2	H	H	H	OPr OBut	OPh OPh
	Me Mo	Me Me	н	H	2 2	H	H	H	OCH ₂ Pr-c	OPh
1									_	
1	Mu	Me	н	H	3	11	il	H	OCH ₂ Bure	OPh
1	Me	Me	H	H	2	H	H	H	OCH, Pen-c	OPh
1	Me	Me	Н	H	2	Н	И	H	OCH2Hex-c	OPh
	Me	Me	H	H	2	H	H	H	OPen·c	OPh
	Me	Mo	H	H	2	H	H	H	OHerc	OPh
	Mc	Me	H	H	2	H	H	H	OCH-Ph	OPh
	Me	Me	Hi	н	2	H	Н	н	OPh	OPh
ı	Me	Mo	H	H	2	H	H	н	OCHF _E	OPh
ı	Mę	Me	H	H	2	н	H	Н	SH	OFF
	Me	Me	Н	H	2	н	H	H	SMe	OPh
ı	Me	Me	H	Н	Ż	H	H	н	6O₂Me	OPh
1	Me	Me	H	н	ż	H	H	H	SEE	OPh
1	Me	Me	H	н	2	Н	H	H	\$0 ₂ Et	OPh
١	Me	Mo	Н	н	. 2	14	H	н	SPr-i	OPh
1	Me	Me	H	Н	2	Ħ	H	H	SO ₂ Pr·i	OPh
١	Me	Me	H	и	2	н	H	Н	&Ph	OPb
1	Mo	Me	H	H	2) į	H	н	SO₂₽ħ	OPh
1	Me	Me	н	H	2	H	H	H	SCHF ₂	OPh
	Me	Me	H	Н	2	H	H	H	SO ₂ CHF ₂	OPh
١	Me	Me	11	H	2	н	н	H	NH.	OPh
١	Mo	Me	H	н	2	н	и	H	NHMo	GPh
ı	Me	Me	Н	H	2	H	H	н	NMe:	OPh
١	Me	Me	н	H	2	н	H	н	NHE	OPb
١	Me	Me	H	H	2	H	Ħ	н	NEt,	OPb
Į	bie	Me	н	н	2	н	н	J-J	NHPh	OPh
	Me	Me	H	H	2	Н	H	Ŀi	N(Me)Ph	OPh
	Mo	Me	H	н	2	H	Н	H	CN	OPh
	Me	Me	н	Н	2	Н	H	H	F	OCHE:
	Me	Me	H	Н	2	H	H	Н	OH	OCHTE
	Me	Me	H	H	2	н	H	[·]	OMe	OCHF2
ł	Me	Me	H	н	2	H	H	н	OEi	OCHP.
ı	Me	Me	н	L1	2	H	H	HI.	OPr-i	OCHP.
ı	Me	Me	Н	[-]	2	H	Ħ	H	OP _Y	OCHE.
	Me	Me	Н	H	2	H	н	н	OBu-t	CCHF.
1	Me	Me	H	H	2	н	н	H	OCH Pre	OCHP2
	Me	Mo	Н	H	2	H	Н	H	OCH ₂ Burc	OCHE,
	Me	Me	н	Н	2	11	н	9	OCH Pen-o	OCHF.
	Me	Me	н	B	2	Ħ	Ж	A	OCH, Hexe	OCHF ₂
	Me	Me	н	Ä	2	H	Н	e e	OPen c	OCHP ₂
Ì	Ale	Me	n	LI.	2	н	H	Ř	OHerro	OCHP.
- 1		////	L^^	_ ``					within t	

[0137]

【费96】

(105)

207

特闘2002-308857

208

		·-								•	۰
	R!	R ^a	R³	R ⁴	n	R ^b	R	R ³¹	R ⁴⁵	R44	l
	Me	Me	H	H	2	H	H	н	OCH,Ph	OCHF,	ı
	Me	Me	H	н	2	H	H	н	OPh	OCHP,	ı
	Mo	Me	H	н	2	H	н	14	OCHF2	DCITR*	ı
	Me	Me	H	н	2	H	H	H	SH	OCHF _s	ı
	Me	Me	H	Н	2	H	н	н	8Ma	OCHF,	ĺ
	Me	Me	14	и	7	EI .	It i	11	SO,Me	OCHF2	ĺ
	Me	Mc	Ħ	H	3	H	H	Н	SEt	OCHF.	
	Me	Mo	H	н	2	H	H	H	SO ₂ Et	OCHF.	
	Me	Me	н	н	2	H	H	н	SPri	OCRF,	ł
	Me	Me	H	И	2	Н	H	н	SO ₂ Pri	OCHF,	l
	Me	Me	н	Н.	ż	н	н	H	&Ph	OCHF ₂	
	Me	Me	H	н	2	H	H	H	SO ₂ Pl ₃	OCHF.	
	e <u>M</u>	Me	H	Н	2	[]	H	Н	SCHF ₂	OCHF,	
	Me	Me	н	H	2	H	H	н	SO ₂ CHP ₈	OCHF2	ĺ
-	Me	Me	H	H	2	El	H	Н	NHq	OCHF.	
	Me	Me	H	H	2	Н	н	н	NHMe	OCHT.	
1	Me	Me	П	H	2	н	H	ਮ	NMez	OCHF:	
	Me	Me	Н	н	3	H	H	H	NHEt	OCHF,	í
	Me	Me	H	н	2	н	H	н	NEt ₂	OCHF,	i
	Me	Me	J-I	н	ያ	н	н	H	NHPh	OCHF:	
	Me	Me	Н	H	2	H	H	н	N(Me)Ph	OCHF,	
1	Me	Me	H	31	2	ш	II.	Н	CN	OCHF:	Į
ı	Me	Me	н	н	2	H	Ħ	Me	¥	CF ₃	
ı	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	Ci	CF ₃	
	Me	Nle	П	H	2	H	H	Me	OH	CF,	
	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OMe	CF ₂	
	Me	Me	Н	И	Ż	H	H	Me	OEt	CF ₂	
١	Me	Ma	H	H	2	H	H	Me	OPrei	CF ₃	
١	Me	₩e	H	н	2	H	Ħ	Mo	OPr	CF,	
١	Me	Mə	H	Н	2	H	н	Me	OBu-t	CF,	
١	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OCH ₂ Prc	CF ₈	
١	Mc	Me	н	H	2	H	H	Me	OCI12Bure	CF,	
1	Me	Me	н	н	2	H	H	Me	OCH ₄ Penc	CF ₀	
-	Me	₩e	H	H	2	H	H	Me	OCH _B Hex-c	CF,	
1	Me	Me	н	H	2	H	H	Me	OPen·c	CF,	
l	Me	Me	н	H	2	H	н	Me	OHex.c	CF:	
1	Me	Me	H	H	2	н	H	Mo	och _r ph	CF,	
1	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	OPh	CF,	
	Me	Me	H	H	ઢ	н	H	Мe	OCHF.	CF4	
	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SH	CF,	
١	Me	Me	H	H	2	н	H	Mo	SMe	CF,	
١	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	SO,Me	CF,	
	Me	Mo	н	H	2	H	H	М±	8Et	CF ₅	
-	Me	Me	H	H	2	H	H	Me	8O₂Et	CF ₃	
	Me	Mo	H	H	2	H	H	Me	SPri	CF ₃	
	Мo	Me	H	Н	2	H	H	Me	SO ₂ Pr-i	CF,	

[0138]

【表97】

(106)

209

特闘2002-308857

210

R'	R²	R'	R4	n	R ⁶	Ra	R ⁴¹	R ^{ca}	R ⁴⁷
Mə	Me	H	H	2	Н	Ħ	Me	SPh	CF ₅
Me	Me	π	H	2	H	Ħ	Me	SO ₂ Ph	CF ₃
Me	Mc	H	н	2	H	Ħ	Mo	SCHF,	CF,
Mie	Me	H	н	2	[1]	El	Me	SO ₂ CHP ₂	CF,
Me	Me	H	H	2	H	H	Me	NH2	CF.
Me	Me	H	н	2	H	H	Me	NHMe	CF ₃
Мe	(Vle	н	н	2	н	H	Me	NMeg	CF.
Me	Mo	H	Н	2	Н	H	Mo	NHE	CF,
Me	e l st	н	Ħ	2	H	H	Me	NEt,	CF,
Me	Me	H	H	2	н	н	Me	NHPh	CF,
Mc	Me	н	H	2	H	н	Me	N(Me)Ph	CF,
Me	Me	н	11	2	н	н	Me	CN	CF.
Me	Me	H	H	5	Ħ	Ħ	OMe	F	CF.
Me	Me	Н	H	2	H	н	OMe	C1	CF ₂
Me	Me	H	H	2	H	Н	ÜMe	OH	CF;
Me	Me	н	н	2	H	H	OMe	OMe	CF.
Me	Ma	Н	H	2	Ħ	н	OMe	0Et	CF ₂
Ma	Me	H	Н	8	t!	н	QMe	Or-i	CF,
Me	Me	H	н	2	H	н	OMe	OPr	CF,
Me	Me	H,	н	2	H	H	СМе	OBu-t	CF,
Me	Me	H	н	Ż	14	H	OMe	OCH ₂ Pr·c	CF ₃
Me	Me	H	Н	2	H	H	OMe	OCH ₂ Buc	CF;
Me	Ms	H	н	2	H	н	ONe	OCH ₂ Pence	CF,
Me	Me	И	н	호	Н	H	OMe	OCH2Hexre	CF.
Me	Me	H	H	2	H	H	QMe .	OPen·c	CF,
Me	Mo	H	H	2	H	Ħ	OMe	OH÷z.c	CF ₃
Bise	Me	H	н	Ż	H	H	OMe	OCH,Ph	Cit.
Mc	Me	H	H	2	н	н	OM.⊎	OPh	CF;
IA∉	₽le	н	H.	?	н	II	OMa	OCHF ₂	CF,
Me	Me	Н	I-j	3	H	H	OMe	SH	CP,
Me	Me	H	H	2	H	Н	OMe :	SMe	CF,
Me	Mo	H	H	2	H :	H	OMe	SO₃Me	CF,
Me	Me	Н	8	2	H	Н	OMe €	SEŁ	CF ₂
Me	Me	Н	H	2	H	Н	OMe	SO ₂ Et	CF,
Ме	Me	H	H	2	H	H	OMe OMe	SPri	CF,
Mo	Me	н	9	2	H	H	OMe	SO ₂ Pri	CF ₃
Me	Me	H	ᇤ	2	H	H	OMe	SPh	CF,
Me Me	Me	H	H	2	H H	H	OMe OMe	SO ₂ Ph SCHF ₂	CF ₃
Me	Me Me	H	n H	2		H	OMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Mo	a	H	2	H	H	OMe	NH,	CF,
Me	Me	H	H	2	н	H	UMe	NHMe	CF ₃
Me	Me	Н	н	2	н	н	OMo	NMe ₂	CF ₃
Me	Me	Н	H	2	н	И	OMe	NHE:	CF3
Me	Me	н	н	2	н	H	Ohle	NEte	CF ₃
Me	Me	н	н	3	H	н	OMe	NHPh	CF,
157E	ме	ות		ٽا	, ,,		Orde	i irrur n	3

[0139]

【表98】

(110)

217

特闘2002-308857

218

R ¹	R ^q	R3	R ⁴	B	R ⁵	R ⁿ	R ^{II}	R42	Ra
	Hair	Ĥ	H	2	Ю	H	H	OEt	ĈF,
(C	11213	н	н	z	LI	11	11	OMe	CF ₃
-(0	H ₂),	н	н	2	U	H	H	GEt.	CF,
	H ₂) ₄ .	н	н	2	н	H	н	OMe	CF:
	H ₂) ₄ -	H	H	2	H	H	H	OE1.	CF.
1 10	17.2/4			_		8			
40	H2)5.	H	H	2	l·l		13	OMe	CF,
	113)4.	H	H	2	н	H	H	OEt	Ck ³
H	-{CH ₂		H	2	Н	H	H	OMe	CF ₂
H	·(CH ₂		H	2	H	H	H	QE t	CF3
н	(CH		н	2	H	H	13	OMe	CF4
H	·(CH ₂) _{(**}	н	2	Н	H	H	OEt	CF,
H	-(CH ₂),·	H	2	H	H	H	OMe	CF,
H	·(CH ₂) <u>.</u> .	H	2	H	н	H	OEt	CF,
н	√CH,		н	2	H	нI	н	oMs	CF.
1 11	-(CH	<u>. </u>	н	3	H	н	H	GEL	CF.
Mo	Me	H	H	ı	н	н	H	Cl	CI
Me	Me	Ĥ	Ĥ	î	H	H	H	ÓН.	Ci l
Me	Me	H	jį.	î	1.1	н	H	OMe	C1
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	H	OBt	Ç1
Me	Me	Н	И	1	H	H	н	OPri	CI
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPr	ต ต
Me	Me	H	H	i i	H	H	11	OBurt	a
Me	Me						1	OCH ₂ Pr·c	
Me	Me	H	Н	l	Н	H	H	OCH ₂ Bure	Cl
Me	Мą	H	н	1	H	H	Н	OCH2Pentu	લ
Me	Me	11	11	L	H	н	н	OCH Hearc	CI
Me	Me	H	H	1	H	Н	H	OPen-c	CI
Me	Me))	IL	!	H	H	H !!	Office	G
Me	Me	н	н	!				OCH₄₽ħ O₽ħ	
Me	Me	H	H	l i	H	Н	H	OCHE,	CI CI
Me	Me Mo	H	H	l L	H	н	н	SH	Ca
Me Mc	Me	H	Я	1	H	н	Ĥ	SMe	ñ
Mc	Mc	и	н	ì	Ĥ	н	н	SO ₂ Me	ä
Me	Me	н	н	i	H	н	Н	SEt	Ċ
Me	Me	11	31	i	н	н	н	SOLE	ดี
Me	Мь	H	14	ì	H	H	H	SPri	ci
Ma	Me	H	H	1	H	H	H	SO Pri	a
Me	Me	H	Н	1	H	н	н	sPh	CI
Me	ьМ	н	Н	1	H	н	H	SO ₂ Ph	CI
Me	Mo	H	JÆ	ı	H	н	H	SCHF,	Ci
Me	Me	н	н	1	H	н	н	SO ₂ CHF ₂	Ci
Me	Me	н	н	ï	H	H	н	NH.	Cl
Me	Me	Ĥ	н	li	н	H	H	NHMe	Či
èle	Me.	н	H	;	H	13	н	NMe ₂	ci i
Me	Me	н	н	١٠	н	н	н	NHEL	Cl
Me	Me	H	н	l i	H	H	H	NEL,	ci
Me	Me	н	н	l i	H	11	I-1	NHPh	CI
Me	Me	Н	H	1	H	Ħ	H	N(Me)Ph	CI
Me	Me	Ħ	Н	1	н	Ħ	H	CM	C1
Me	Me] H	H _		H	H	H	P	Me

[0143]

【表102】

(111)

219

特闘2002-308857

220

R1	\mathbb{R}^2	R.1	R ¹	ת	R3	R®	R ⁴¹	R12	R. ²⁴
Me	Me	Н	H		Н	H	н	Cl	Me
Mc	Me	H	н	1	H	E	ŀΙ	OH	Me
Me	Me	H	H	1	В	H	ŀΙ	Obte	Me
Me	Me	H	H	1	8	H	H	OEL	Me
Me Me	Me Me	H	H	1	H H	H	H	OPri	Me
Me	Me	H	н	1 1	H	H	H	OPr OBurt	Me
Me	Me	H.	н	i	R	H	И		Me
Me	Me	H	н	i	H	H		OCH _e Pro	Me
		l					H	OCH ₁ Bure	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	Н	OCH Penc	Me
Me	Me	H	Н	1	H	H	Н	OCH Hex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	н	OPenre	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	И	Н	оснурь	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OPh	P76
:Me	Me	H	H	1	R	El	Н	OCHF ₂	Me
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	H	SH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	н	SO ₂ Me	Me
Me	Me	Н	Н	1	H	H	H	SEt	Me
Me	Me	H	н	1	H	Ħ	Н	SO ₂ Et	Me
Me	Mc	H	H	1	H	H	И	SPr-i	Mo
Me	Me	H	H	1	H	H	Н	80 ₂ Pri	Me
.Me	Me	[[H	1	B	Ħ	H	SPh	Me
. <u>V1</u> e	Me	H	h	1	H	н	н	SO₂₽ħ	Me
.Me	Me	AT.	H	1	H	H	н	SCHF,	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO _k CHF ₂	Me
Me	Me	Π	¥ī.	1	D	n	11	NH,	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	н	NHMe	Me
Me	Me	H	H	i	В	H	Н	NMe ₂	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	ਸ	NHE	Me
Ne	Me	Н	I4	i	H	ñ	H	NE	Me
Me	Me	Н	14		н	н	н	NHPL	Me
Me	Me	н	H	i	H	H	н	N(Mc)Ph	Me
Me	Me	H	H	1	H	н	H	CN	Me
Me	Me	н	H	L	н	H	14	F	Pr•i
Me	Me	ü	ii ii	1	H	H	н	ÇI	Peri
Me Mo	Ma	H	H	!	Ħ	H	H	OH	Pri
Mo	Me M⊎	H	H	1	H	H	H H	OMe OEt	Pr-i Pr-i
Me	Me	H	H	i	8	H	н	OPr-i	Lt.
Me	Me	H	H	i 1	H	н	H	OPr	Pri
Me	Me	H	й	i	Ĥ	n	н	OBu-t	Pr-i
Me	Me	Hi	н	i	H	H	н	OCH ₂ Pro	Pri
Me	Me	н	H	ı	H	н	н	OCH ₂ Berc	Pri
Me	Me	H	H	i	H	H	H	OCH Pence	Pri
Me	Me	н	н	i	H	8	н	OCH Hex-c	Pr-i
Me	Mc	H	н	i	H	મ	н	OPen c	Pri
Me	Me	H	Ĥ	î	H	H H	Ĥ	OHexac	Pri
Me	Mo	H	н	î	H	E	н	осн.рь	Pri
Me	Me	H	н	i	В	H	Н	OPh	Pri
Me	Me	H	н	1	H	н	н	OCHF ₂	Pri
Me	Me	н	н	1	H	H	H		Pr∙i

[0144]

【表103】

(110)

特開2002-308857

217

Γ	R1	R ^t	R3	R ⁴	В	R ⁵	Ra	R.11	R-*2	R ⁴³
Γ	-(0	H ₂ i ₂ ·	H	H	2	В	H	H	OEt	CF,
Т	·(c	11213	H	н	ž	tī l	n l	11	OMe	CF ₃
Т	·(C	H.).,	н	Н	2	U	H	н	OE:	CF,
1	-(0	H ₂) _e ·	H	Н	2	н	H	н	OM _t	CF.
	-(r	H ₂) ₄ -	н	H	2	н	H	H	OE:	CF,
ı		H ₂) ₅ .	н	н	2	B	H	13	OMe	CF ₃
ı		113)2.	н	H	2		ี น	н	ORt	
-	H	-(CH		н	2	H	H			Cr,
						H		H	OMe	CF ₃
ı	H	-(CH		H	2	H	H	H	Q£t	CP,
	H	·(CH		H	2	H	н	13	OMe	CIF ₄
	H	·(CH,	de'	Н	2	Н	H	Н	OEt	CF ₂
1	H	·(CH ₂	۶,۰	H	2	Н	H	H	OMe	CF ₅
ı	Ħ	·(CH ₂		H	2	H	н	H	OEt	CF ₅
П	H	·(CH,		H	2	Ħ	H	H	aMO	CF,
1	H	-(CH) _* -	H	3	H	н	H	GEL	CF.
ı	Me	Me	H	Н	1	H	H	H	Cl	Cl
1	Μ÷	Me	Н	н	1	H	H	H	OH	Ċl
1	Me	Me	H	11	1	ij	Ħ	H	OM ₂	Q.
1	Me Mç	Me Me	H	H	1	H	Ħ	Ħ	Oßt OPri	22
	Me	Me	H	H	i	H	н	H	OPr	Ö
1	Me	Me	H	ਮੇ	i	Ĥ	Ĥ	H	OBus	લ
ł	Me	Me	н	н	ı,	Н	н	11	OCH ₂ Pr·c	ମ
	Me	Me	н	н	lι	н	н	н	OCH ₂ Bure	Ċì
1	Me	Ma	н	н	ı	H	Н	Н	OCH Pent	લ
1	Me	Me	11	11	li	н	н	н	OCH Here	CI
1	Me	Me	н	Н	i	н	н	H	OPen-c	(4
ı	Me	Me	îi	ii	i	Н	н	H	o.zeHO	CT
ı	Me	Me	H	н	Ţ	H	Н	!!	OCH⁵5₽	(3
1	Me	Me	H	Н	ı	H	H	H	OPh	ପ
ı	Me	Me	H	H	l l	H	н	H	OCHF.	a
1	Me	Mo	H	н	L	H	H	H	SH	Ca
1	Mc	Me	H	H	ì	H	H	Н	Sivie	_ <u>ო</u>
Ţ	Mc	Mic	H	H	Ł	H	H	Н	SO ₂ Me	G
1	Me	Me	H	H	L	H	H	H	SEt	(i)
1	Me Me	Me Mo	11 H)[H	i	H H	н	H	SO _z Et SPr-i	a
	Mis	Me	8	Н	i	H	H	H	SO ₂ Pri	ä
	Me	Me	H	н	ì	H	H	н	SPh	ä
	Me	om:	H	H	i	H	Н	H	SO ₂ Ph	ă
	Me	Ma	ii	H	i	H	н	н	SCHF,	Ci
1	Me	Me	н	н	ì	H	н	H	SO ₂ CHF ₂	Ci
	Mic	Me	н.	н	ì	H	H	н	NH ₂	ci
	Me	Me	н	H	;	н	H	H	NHMe	ci ci
	de	Me	Н	H	;	н	13	и	NMe ₂	ci
1	Me	Me	н.	н	١	н	H.	н	NHEL	a
1	Me	Nie	H	Н	i	H	H	н	NEL,	ä
	Me	Me	н	н	i	н	Ħ	Н	NHPh	ä
	Me	Me	Н	Ĥ	i	H	ü	H	N(Ma)Ph	CI
	Me	Me	H	H	3	И	Ħ	H	CM	Ca
L	Me	Rfe	И	I·I)	Н	<u>H</u>	н	Ą	Me

【表102】 [0143]

(111)

219

特闘2002-308857

220

R!	R ³	R ^A	R ⁴	n	R ³	R	R ⁴⁸	R18	R ¹²
Me	Me	H	H	l "	H	H	H	Ci	Me
Me	Me	H	H	i	H	Ei	H	OH	Me
Me	Me	H	H	Ιī	H	61	Н	OMe	Me
Me	Me	H	Н	l î	ĺ	Ĥ	Ĥ	OEi	Me
Me	Me	H	H	i i	Ĥ	Н	Ĥ	QPri	Me
Me	Me	H	H	1	H	Н	H	OPr	Me
Me	Me	H	H	1	H	н	Н	OBurt	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	И	OCH ₂ Pro	Me
Me	Me	н	H	1	H	H	н	OCH ₂ Bure	Me
Me	Me	H	H	ı	H	н	н	OCH Penc	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	н	OCH Hex-c	
Mc	Me	H	H	1	H	H	H	OPen-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHex-c	Me
Me	Me	H	H	1	H	U	н	ОСНуРЬ	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	н	OPh	MA
Me	Me	Ĥ	\$1	1	K	H	J-I	OCHF ₂	Me
Me	Me	Ħ	H	1	H	Ħ	H	SH	Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SMe	Me
Me	Me	H	H	ı	H	Н	н	SO _s Me	Me
Me	Me	H	н	1	H	H.	н	SEt	Me
.Me	Me	H	н	1	Н	Я	н	SO ₂ Et	Me
Me	Mc	H	Н	1	Н	H	И	SPr-i	Mo
Me	Me	H	H	1	H	H	Н	80₂Pr-i	Me
Me	Me	II	H	1	13	η	н	SPh	Me
Me	Me	H	h	ï	H	н	H	SO ₂ Ph	Me
Мe	Me	A	н	1	H	n	н	SCHF,	Me
:Me	Me	H	H	1	H	H	H	SO,CHF.	Me
Me	Me	Œ	ĬĬ	1	i)	l n l	II	VH,	Me
Me	Me	H	н	1	H	н	н	NHMe	Me
Me	Me	H	н	i	В	Ħ	н	NMe ₂	Me
Me	Me	4	H	ī	H	H	ਸ	NHEt	Me
Me	Me	н	ii	î	H	ñ	Ĥ	NE	Me
Me	Me	H	Н		н	н	H	NHPL	Me
Me	Me	H	н	1	H	H	Ж	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	1	Н	н	H	CN	Me
Me	Me	H	H	L	н	H	14	F	Pr-i
Me	Mie	u	ł1	1	Н	H	H	ÇI	Peri
Me	Me	H	ļi 77	!	H	H	H	OH	Pri
Mo Mo	Me Me	Ħ	H	1	H	H	H	OM:	Pri
Me	Me	H	H	1	H	H	н Н	OEt OP7-i	Pr-i Pr-i
Me	Me	н	H	i i	Ĥ	n	, ji	OPr	Peri
Me	Me	Η̈́	й	i 1	Ä	n l	ਸੰ	OBu-t	Pri
Me	Me	H	н	i	H	H	н	OCH ₂ Pro	Pri
Me	Me	H	H	i	Н	H	н	OCH ₂ Borc	Pri
Me	Me	Ħ	H	1	н	H	Н	OCH Pence	Pri
Мe	Me	H	н	1	H	H	н	OCH Hex-c	Pr-i
Me	Mc	Ħ	н	1	H	स	н	OPen c	Pri
Me	Me	H	Н	1	H	H	Н	OHexrc	Pri
Me	Mo	H	н	1	H	Ei	H	ОСИ,РЪ	Pri
Me	Me	H	H	1	Н	H	H	OPh	Pri
Me	Me	H	н	1	H	н	н	OCHF ₂	Prri
.Me	Me	н	H	1	H	н	H	SH	Pri

[0144]

【表103】

(112)

特闘2002-308857

222

	221								
R'	R ³	B.3	R'	9	Rb	R*	Ra	Res	R.48
.Me	Me	Ħ	H	ī	Н	H	H	SMe	Pru
Me	Me	H	H	1	Н	H	H	SO _z Mo	Pru
Me	Ms	H	H	ı	H	H	н	SEt	Pr-t
Me	Me	H	н	1	lн	H	31	30,Et	Pri
Mo	Me	н	н	1	н	н	н	SPri	Pri
Мe	Me	н	н	ı	[-]	н	н	SO ₂ Pr-1	Pres
Me	Me	H	н	1	H	н	н	SPh	Pri
Me	Мo	н	н	ı	H	H	H	SO ₂ Ph	Pri
Me	Me	н	н	lı	н	н	н	SCHP,	Pri
Мe	Mo	14	н	Īī	G	н	н	SO,CHF.	Pro
Мe	Me	H	н	li	н	6	н	NH.	Pres
Me	Me	н	Н	li	H	ä	H	NHMe	Pro
Me	Me	н	H	l i	H	н	H	NMe _z	P yri
Me	Me	H	Ĥ	Î	H	н	H	NHEL	Pri
Me	Me	H	H	l i	H	H	H	NEtz	Pri
Me	Me	H	н	i	[]	[i	H	NHPb	Pri
Me	Me	н	Н	ì	[4]	ä	H	N(Ma)Ph	Pri
Me	Me	H	H	li	н	H	Ĥ	ÜN	Pı-i
Me	Me	н	H	l i !	H	Й	H	F F	Pre
Me	Me	H	H	1	H	Ð	Н	C1	Proc
Me	Me	H	н	1	H	Ħ	H	OH	Pre
Me	Me	н	H	1	H	н	H	OMe	Pre
Me	Me	H	н	1	н	H	H	OEt	Pro
Me	Me	R	Н	1	H	F	H	OPr-1	Pr·c
Me Me	Me Me	H	H H	1	H	H	H	OPr OPr	Pre
Me	Me	H	н	l i	H	H	н	OBu-t	סיינו
Me	Me	H	н			H	Н	OCH ₂ Prc	Pro
				1	H			OCH ₂ Burc	Pro
Me	Me	H	Н	1	H	H	H	OCH,Pun'c	Pro
Me	Me	TI I	31	1	EI .	n	11	OCH3Hex.E	Pre
Me	Me	H	H	!	H	H	н	OPearc	Perc
Me Me	Me Me	日日	H	1	H	H	H	OHex.c	Pre
Me	Me	H	H	i	A	H	н	OCH ₂ Ph OPh	Pre
Me	Me	н	н	l i l	н	н	н	OCHF.	Pro Pro
Me	Me	H	ii.	i	H	# H	H	SH	Pro
Me	Me	ЙΙ	H	l i l	Ĥ	йI	H	SMe	Pro
Me	Me	H	H	i	н	н	H	SO,Me	Proc
Me	Me	н	H	ī	н	н	H	SEt	Pro
Me	Me	н	H	il	н	н	Ħ	SO ₂ Et	Pro
Me	Me	н	H	i	н	н	H	SPri	Pre
Me	Me	н	H	i	H	н	Ħ	SO ₂ Pr i	Pro
Mie	Me	H	H	î	н	H	H	SPh	Pro
Me	Me	н	H	ū	н	Ĥ	ਮੌ	SO,Ph	Pre
Me	Me	я	H	ΙiΙ	H	н	H	SCHF.	Pre
Me	Me	н	H	i	Н	н	Ħ	SO ₂ CHP ₂	Pric
Me	Mo	H	H	i	H	н	Ħ	NH,	Pro
Me	Me	H	H	1	H	H	H	NHMe	Pro
Me	Me	Ĥ	H	i	Ĥ	🛱	ĸ	NMe.	Pira
Me	Me	12	H	i	H	н	H	NHE	Pre
Me	Me	HT	H	i	H	н	H	NEt ₂	Pre
Me	Me	Ĥ	H		H	H	H	NHPh	Pro
1176	4.95						1.0	******	

[0145]

【表104】

(113)

223

特闘2002-308857

224

R'	R ^t	R,	Rª	ת	R ³	Re	R44	R⁴R	R ^{ft}
Me	Me	н	H	1	H	H	II	N(Me)Ph	Pro
Me	Ms	Ħ	H	1	H	H	H	CN	Prc
Me	Me	н	H	1	H	н	1-7	P	CHIP
Mc	Me	H	Н	1	H	н	н	Cl	CHP ₂
Me	Me	H	н	1	н	H	Н	DН	CHE
Me	Me	Ħ	н	1	н	H	н	OMe	CHF ₂
Me	Me	H	Н	1	H	H	H	OEŧ	CHF2
Мя	Me	H	н	1	н	н	н	OPr-i	CITE
Me	Me	H	H	ı	И	Ħ	H	OPr	CHF.
Mβ	Me	H	н	1	H	H	}?	∂Bu•ŧ	CHF2
Me	Me	н	н	1	H	н	Н	OCH ₂ Prrc	CHP.
Me	Mo	H	И	1	Н	н	H	OCH2Bure	CHIP,
Me	Me	н	13	ı	H	H	H	OCH,Pen'c	CHIP.
Me	Me	н	н	1	н	н	Н	OCH, Here	CHF
Ms	Me	н	Н	ī	H	н	Н	OPen-c	CHF ₂
Me	Me	н	н	1	Н	н	н	OHex-e	CHF2
Me	Me	H	14	1	H	H	H	OCH _u Ph	CHIF3
Mc	Me	н	н		Н	н	H	OPh	CHIP,
Me	Me	н	н	li	11	Ħ	Н	OCHF.	CHF2
Me	Me	H	н	1	H	н	Н	SH	CHF.
Me	Me	H	н	ī	H	н	н	SMe	CHF2
D1e	Me	11	11	l	Н	н	H	SO ₂ Me	CHIF ₂
Me	Me	н	14	ı	н	н	н	SEt	CHP,
Ma	Me	н	Jŧ	ı	н	н	н	SO ₂ Et	UHM,
Me	Ma	н	н	1	H	H	H	SPri	CHF.
Me	Me	H	н	1	H	н	H	SO ₂ Pr-i	CHF,
Me	Me	H	H	1	н	Ы	н	ક્ષમ	CHF,
Me	Me	н	H	1	н	н	н	SG ₂ Ph	CHF,
Me	Me	н	jξ	ı.	H	н	н	SCHF.	CHP.
Me	Me	H	н	ì	H	н	н	SO ₂ CHF,	CHF:
Me	Me	н	н	ı	H	н	H	NH,	CHIF
Me	Me	н	14	ı	H	н	H	NHM	CHF,
Me	Me)]	36	ı	Ħ	н	н	NMe ₁	CHF _a
Me	Me	H	H	1	H	Н	н	NHEL	CHF2
Me	Me	H	н	ı	H	н	Н	NEE.	CHF2
Mie	Me	H	н	ı	Hi	H	н	NHPh	CHE
Mic	Me	н	н	ì	H	н	н	N(Me)Ph	CHF ₂
Me	Me	H	н	ı	H	н	H	CN	CHFe
Me	Me	н	н	ι	H	14	н	F	CF.
Me	Me	Ħ	Н	1	н	н	н	Ci	CF.
lie	Me	u	н	L	н	H	н	OH	CF,
Me	Me	н	н	1	H	H	H	OMe	OF:
Me	Me	Н	H	1	H	H	H	OEŧ	CF,
Me	Me	H	T-1	1	H	н	н	OPr-i	CF,
Me	Me	н	H	1	H	H	н	OPr	CF,
Me	Me	н	н	1	H	ŧi	н	OBart	CP)
Me	Nie	Н	H	<u>)</u>	н	Ħ	н	OCH,Pr-c	CF,

[0146] [表105]

(114)

225

特闘2002-308857

22

R'	R1	R ³	R1	n	R	F.¢	R41	R ⁴⁷	Ris
Me	Ms	H	H	I	H	H	1-1	OCH ₂ Bure	CF.
Me	Me	Б	H	ı	B	11	11	OCH Peor	CF3
Ме	Mo	н	H	1	н	н	H	OCH2Her-e	
Me	Me	Н	H	ı	H	ы	14	OPenic	CP,
Me	Me	H	14		H	H	Ħ	Ollexic	CF.
Me	Me	Н	11	li	H	Н	н	ОСНеРы	CF,
Me	Me	н	H	ì	H	н	Н	OPh	CF _a
Me	Me	Н	ìĩ	i	n	н	н	OCHF.	CF.
Me	Me	Н	н	i	н	н	l й	SH	CF,
Me	Me	н	H	ì	'n	II	17	SMe	CF ₃
Me	Me	н	H	i	н	н			Cra
Me	Me	н	H		н	H	H	30 _k Me	CF _s
Me				1 -	1	1	H	SEI	CF,
	Me Me	H	H	1	H	H	H	SO ₂ Et	CF ₀
Me		Н	H	1	H	H	H	SPr-i	ÇF ₃
Me	Me	H	H	1	H	н	Н	SO ₃ Pr-i	CF,
Mc	Me	H	H	1	н	H	H	SPh	CF8
Me	Me	Н	H	1	н	н	H	SO,Ph	CF ₃
Me	Me	н	н	1	H	H	H	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Н	н	н	SO ₂ CHF ₂	CF ₂
Me	Me	И	lt	1	H	H	H	NH ₂	CF _q
Me	Me	н	H	1	Н	н	H	NHMe	CF,
Me	Me	H	H	1	Н	н	H	NMe,	CF ₃
Me	Me	н	H	ı	н	H	H	NIIEt	CF,
Me	Me	н	H	1	Н	Н	н	NEte	CF ₃
Me	Me	н	н	1	н	B	н	NHPh	CF,
Me	Me	HI	н	1	н	н	H	N(Me)Ph	CF ₃
Me	Мe	H	н	ı	н	H	н	CN	CF,
Me	Me	H	Ħ	1	H	H	H	F	O.Me
Me	Me	H	H	1	H	H	H	On	OM ₀
Me	Me	H	н	1	H	EI	H	OMe	O.Me
Me Me	Me Me	H	H	1	H	H	H H	OEt OPr∙i	OMe OMe
Me	Me	H	H	ì	H	H	Ĥ	OPr	OMe
Me	Me	H	H	i	H	H	Ĥ	OBu-i	OMe
Me	Me	AT	н	1	н	n	H	OCH ₂ Pre	OMe
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	Ħ	OCH ₉ Burc	OMe
Me	Me	H	H	1	Ħ	H	н	OCH Penc	OM ₀
Me	Me	H	H	ı	н	H	н	OCH Hex r	OMe
Me	Me	H	н	1	H	H	H	OPen.c	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OHexic	OMe
Me	Me	벖	Ħ	1	н	ᅤ	н	OCHirp	OMe
Me Me	Me Me	H	H	1	H	Ħ	H	OPh	OMe
Me	Me	H	Н	1	н	H	H H	OCHF ₂	OMe OMe
Me	Me	A	H	1	H	н	H	SH SMe	OMe OMe
Me	Me	H	н	i	H	E	H	5O₂Me	OMe
Me	Me	H	н	i	н	Ħ	ਸ	SE	OMe
Me	Me	Ħ	H	1	н	ਜ	Ħ	SO ₂ E).	OMe
Mo	Ме	H	H	1	H	H	H	gPr-2	O.Mo

【表106】

[0147]

(115)

227

特闘2002-308857

228

4.1	Ri	R ²	731	_	R ⁶	-31	R ⁴¹	K-13	RO
R1		H	R1 H	n 1	H	17	H		
Me	Me							SO ₂ Peri	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	H	SPh	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	н	SO ₂ Ph	OMe
Me	Me	H	H	1	H	H	Н	SCHF.	OMe
Me	Me	ਮ	Ж	1	19	н	н	SO ₂ CHF ₂	OMe
Me	Me	H	н	1	H	н	H	NII2	OMe
Me	Mo	H	H	i	H	H	H	MHMe	OMe
Me	Me	ĸ	H	1	H	H	H	NM _{0?}	OMe
Me	Me	н	H	1	н	H	H	NHE	OMe
Me	We	H	H	1	H	H	H	NEt	OMa
Me	A t e	н	H	1	н	H	11	NHPh	OMe
Me	Me	H	H	1	FI	H	[·]	N(Me)Ph	OMe
Me	Me	H	H		H	(ī	I-)	CIN.	OMe
Me	Me	H	н	?	H	(1	[·]	F	OPb
Me	Me	H	H	3	11	Ħ	H	OH	OPh OPh
Me	Ma Me	H	H	1	H	H	H	OMe OEt	OPh
Me	Ma	H	H	1	H	H	H	OPr-i	ÓPh.
Me	Me	н	H	i	Ĥ	Ĥ	ii	OPr	OPh
Me	Me	н	H	l i	Ĥ	Ĥ	H	OBurt	OPh
Ble	Me	н	н	ì	H	н	н	OCH ₂ Prc	OPh
Me	Me	н	H	1	H	н	. 11	OCH ₂ Bu-e	ОРЬ
Me	Me	H	н	ì	н	н	!3	OCH Pent	QPh
1					н	н	H		OPh
Me	Me	H	14	1	H	н		OCH Heare	
Ma Me	Me Me	H	H	1 1	Ħ	H	H	OPenic OHexic	OPh OPh
Mo	Me	Н	н	1	л H	Н	H	OCH,Ph	OPh
Me	Mo	н	н	l i	R	ii ii	Н	OPh	OPh
Me	Me	н	н	l i l	Н	н	H	OCHF ₂	OPh
Mo	Me	н	н	li	H	н	H	SH	OPh
Me	Me	н	H	;	Й	H	H	SMe	OPh
Ma	Ms	Н	н	i	H); H	H	SOMe	OPh
Me	Me	H	H	ì	H	n	н	SEt	OPh
Me	Me	н	14		H	H	н	SO, Et	OPh
Me	Me	ii	н		H	H	स	SP _z -i	OPh
Me	Me	H	H	i	ü	н	H	80 _i Pro	OPh
lite	Me	H	Ĥ	1	H	н	н	SPh	ÖPh
Me	Me	н	H	i	H	Ħ	Н	SO _s Ph	OPb
Me	Me	14	H H	,	н	II	H	SCHT.	OPh
Me		H	H		н	11	H	SO ₂ CHP ₂	OPh
	Me			1					- 1
Me	Me	н	H	1	H	H	H	NH ₂	ONF
Me	Me	H	н	1	H	H	H	инме	OPh
Me	Me	Н	H	1	H	H	н	NMe.	OPh
3 te	Me	н	H	1	H	н	H	NHEt	OPh
Mo	Me	Н	н	1	н	H	H '	NEt _e	OPh
Me	Me	H	H	1	H	н	H	NIIPh	OPh
Mo	Me	H	H	1	H	H	H	N(Me)Ph CN	OPh OPh
Me	Me	H	H	1	H	H	H	F	
Me	Me	H	8	l l					OCHF,
Me	Me	田田	H	L	H	H	A	OH.	OCHI ²
λle	Me	H	H	1	II	H	H	OMe	OCHF,
Me	Me	H	H	1	H	H	H	OBt	OCHF ₂

[0148]

【表107】

(116)

229

特開2002-308857

230

									_
R'	H ³	Ro	R's	n	R.5	Rª	8"	R12	Rts
Me	Me	н	H	1	H	H	Н	OPr-i	OCHF:
Mo	Me	6	H	1	н	D	H	OP:	OCHF,
Me	Me	B	H	1	Н	B	H	OBu-t	OCHF,
Me	Me	Н	н	1	н	Ħ	H	OCH2Pre	OCHF.
Me	Mc	H	H	1	H	A.	l II	OCH,Bu-c	OCHF.
Me	Me	H	H	1	H	н	લ	OCH Pent	OCHP.
Me	Me	н	H	1	H	Н	9	OCH, Hex-	
Me	Me	н	Н	1	H	н	н	Ofenc	OCHP2
Me	Me	н	H	1	н	н	н	OHeare	OCHP.
Мe	Мe	н	H	1	н	н	н	OCH,Ph	OCHF.
Me	Me	Н	н	lī	н	н	н	OPh	OCHE.
Me	Me	н	E	Ιî	Н	Ж	н	OCHP.	OCHP,
Mo	Me	13	B	Ιi	H	н	н	SH	OCHP.
Me	Me	ਜ	ë	i	K	н	H	8Me	OCHP.
Me	Me	H	H	i	H	H	н	1	OCHF ₂
Me	Me	H	H	i	H	17	н	SO ₂ Me	
Me	Me	H	H	ì		"		State	OCHP ₂
Me	Me	H	H		H		H	SO ₂ Rt	OCHF _E
Me	Me	н		1	H	H	H	SPri	OCHF.
Me	1		H	1	Н	H	1-1	irf _g O3	OCHF;
1	Me	Н	H	1	Н	H	H	SPh	OCHF ₀
Mo	Me	H	[-]	1	Н	H	Н	80°6P	OCHE3
Me	Me	H	H	1	H	H	н	SCHP ₂	OCHF2
Me	Me	Н	Н	1	H	H	н	SO ₂ CHF ₂	OCHF3
Me	Mc	H	Н	1	R	н	H	NII2	OCHF,
⊍-	Ne	Н	H	1	H	Н	H	NHMe	OCHF ₄
Me	Me	н	11	1	H	н	H	NMe₂	OCHF ₂
Mc	àte	н	H	L	H	н	H	NHEA	OCHE5
Me	Me	н	H	1	H	H	H	NE _t	OCHF2
Me	B/fe	н	ij	1	н	ㅂ	H	NHPb	OCHF2
Me	Me	H	н	L	н	8	H	N(Ma)Ph	OCHE:
Me	Me	H	H	1	H	u	H	CN	OCEF,
Me	Me	Н	ਸ	1	Ш	8	Me	F	CF;
Me	Me	H	H	ı,	H	H	Me	C1	CFs
.Me	Me	н	H	ı	H	H	Me	он	CF ₃
Me	Me	H	14	١	H	H	Me	QMe	CF,
Me	Me	H	H	1	H	н	Me	OEt	CF3
Me	Мe	(I	H) [1	н	н	Me	OPr-i	CF ₃
Me	Me	н	H	1	H	H	Me	ርም	CF ₃
Me	Me	н	н	1	Н	H	Me	OBu-t	CF _d
Me	Me	н	H	1	ਸ	н	Me	OCH _s Prc	CF,
Me	Me	н	н	1	н	H	Mo	OCH ₂ Burc	CFa
Me	Me	H	н	1	н	H	Me	OCH Pente	CFs
Me	Me	H	н	1	H	H	Me	OCH-Hex-c	CF ₅
Mo	Me	H	H	1	H	អ	Me	OPeare	CF ₉
Me	Me	н	u	1	H	н	Me	OHexte	CF ₃
Me	Me	Ηĭ	Ħ	1	Н	Н	Me	OCH2Ph	CF ₃

[0149]

【表108】

2/16/2005

(117)

231

特闘2002-308857

232

R'	R†	R*	P.3	D.	R^	K ₁	R+1	R ⁴³	R ⁴³
Mo	Me	Н	H	1	Н	H	Me	OPh	CF ₃
Me	Ме	ΙÏ	H.	1	H	ਜ	Me	OCHE:	CF _a
Me	Me	H	H	1	H	H	Me	SH	CF ₃
Me	Me	H	Н	1	H	H	Me	SMe	CF ₅
Me	Me	H	н	≀	ŀΙ	H	Me	80aMe	CF.
Me	Me	н	H	1	H	н	Me	SE	CF3
Me	Me	н	H	1	H	H	Me	SO ₂ Et	CF ₃
Me	Me	H	H	t	Н	н	Me	SPr-i	CF _a
Me	Μe	H	11	1	Н	Ħ	Me	\$0,Pri	CF,
Ме	Me	H	32	1	H	Ħ	Ma	SPh	C.F.a
Me	Me	H	H	ı	H	H	Me	SO₂Ph	CF:
Me	Μø	Н	H	l l	H	H	Me	SCHF ₂	CF.
Me	Me	H	H	ı	H	Ħ	Me	SO ₃ CHF ₂	CP ₃
Me	Mc	H	н	1	H	H	Me	NHa	€F ₃
Me	Мs	H	Ж	1	н	Ð	Me	NHMe	€F ₃
Me	Me	H	H	(A	a	Me	NMe ₂	CF.
Mo	Me	14	H	L	H	H	Me	NHE	CF ₅
Nia	Me	H	H	1	H	H	ora.	NEt,	CF:
M≘	Me	н	Н	ı.	H	e	Mo	NHPh	CF,
Me	Me	H	н	i	H	Œ	Me	N(Me)Ph	CP ₃
Me	Me	11	H	1	H	H	Me	CN	CIF ₃
Me	Me	H	Н	1	H	H	O.Me	F	CF:
Me	Me	н	H	1	H	Œ	O.Me	Cl	CF,
Me	Мe	н	H	1	H	Ħ	∩Me	OH	CF.
Me	Me	н	H	1	H	н	OMe	Olvie	CF;
Me	Me	н	H	1	н	H	OMe	OEt	CF ₃
Me	Me	H	H	1	Н	H	OMe	OPrel	CF ₂
Me	Mo	H	H	1	H	H	OW6	OPr	CF ₃
Me	èle elki	H	H	1	H	H	OMe	OBort	CF,
Me	Me	H	[1]	1	H	H	OMe	OCH_Pr-¢	CF,
Me	Me	H	н	1	H	н	OMe	OCH Bure	CF;
Me	Me Me	H	H	1	II H	H	OMe OMe	OCH ₂ Pen-c	CF,
Me Ma	Me	H	н	1	H	и	OMe	OPearc	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	н	OMe	OHexic	CP ₃
Me	Me	H	H		H	n H	OMe	OCH,Ph	CF ₂
Me	Me	H	H	i	H	H.	QMe	OPh	CF,
Me	Me	H	H	ì	н	н	OMe	OCHP.	CF,
Me	Me	н	H	ľi	н	H	OMe	SI	CF ₃
Me	Me	H	н	i	н	H	OMe	SMe	CF,
Me	Me	н	н	î	н	н	OMe	SO ₂ Me	CF,
Ma	Me	н	Hi	1	н	Н	OMe	SEt	CF,
Me	Me	н	н	1	H	И	OMe	SO, Et	CF,
Me	Me	н	н	1	н	н	OMe	SPri	CF ₃
Me	Me	н	H	1	н	Н	OMe	SO ₂ Pri	CFa
Me	Me	H	н	ì	11	н	OMe	SPh	CFs

[0150]

【表109】

(118)

233

特闘2002-308857

234

R'	R ²	E,	R ⁴	n	R ⁵	R	R*t	R*8	R 13
Me	Me	H	H	1	H	Ĥ	OMa	SO ₂ Ph	CF,
Me	Me	II.	II	1	13	a	OMe	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	H	1	H	H	ONic	SO,CHF?	CF,
Me	Me	н	н	1	н	Ħ	OMe	NH ₂	CF _a
Me	Μe	H	н	1	H	H	OMe	NHMe	CF:
Me	Me	н	н	1	H	H	OMe	NMe _t	CF,
Me	Me	н	н.	1	н	H	OMe .	NIE	CF,
Me	Me	H	H	1	Н	H	OMo	NEtz	CF,
Me	Me	H	н	1	H	H	OMe	ИНРЬ	CF,
Me	Me	H	II.	1	H	H	OMe	N(Ma)Ph	CF.
Me	Me	н	H	1	H	н	OMe	CN	CF,
Mo	Me	н	И	ı	H	н	SMe	jr	CF,
Me	Die	н	H	1	H	H	8Me	C1	CF ₃
Me	Mo	н	H	ı	н	н	SMe	OH	CF.
Me	Me	н	н	ì	H	H	SMe .	OMe	CF,
Me	Me	H	н '	!	H	H	SMe	OEt	CF.
M€	Me	H	И	ι	н	н	SMe	OPri	CF ₃
Mu	Me	н	Jž	ı	H	н	\$Me	OPr	Cr.
Me	Me	Ħ	H	1	H	н	SMe	OBurt	CF.
Me	Me	H	н	1	H	H	SMe	OCH ₂ Pr-c	CP,
Me	M∍	H	н	ı	H	н	SMe	OCH ₂ Bure	CF,
Me	Ma	н	H	ι	H	н	SMe	OCH Penc	CF ₃
Me	Me	Ħ	H	Ł	н	н	SMe	OCH2Hex-c	CF.
Me	Me	н	H	j	H	н	SMe	OPenre	CF ₂
Me	Me	Hi	н	L	H	н	SMe	Oliere	CF ₃
Mo	Me	H	н	1	H	н	SMe.	OCH ₄ Ph	CF3
Me	Me	н	н	1	H	Ħ	SMe	OP)ı	CP.
Mo	Mo	н	н	L	H	H	SMe	OCHF,	CF.
à4e	Me	H	H	ı	H	н	SMe	SED	CF,
Me	Me	14	н	ì	H	H	SMe	SMc	CF,
Me	Me	Н	H	1	H	H	SMe) SO,Me	CF ₄
Me	Mo	н	H	ι	13	11	SMe	SBL	CF ₄
Me	Me	н	н	ı	H	H	SMe	SOzEt	CF ₃
Me	Me	н	H	1	H	H	SMe	SPri	CF.
Me	Me	II	H	1	н	Ħ	SMe	SO ₂ Pri	CF:
Me	Me	H	H	1	н	H	SMe	SPh	CF,
Me	Mo	н	H	1	H	H	6Ме	\$Q₂Pb	CF,
We	Me	H	H	1	H	н	SMe	SCHF,	CF:
Me	Me	H	1-1	1	Н	Н	SMe	SO ₂ CHF ₂	CF ₃
Me	Me	H	Į.	1	н	H	5Me	NH ₂	CF ₂
Me	Me	н	H	l	Н	H	\$Me	NHMe	CF,
Me	Me	н	H	l	H	H	ЗМе	NMe ₂	CF ₃
l.le	Me	н	H	1	H	H	SMe	NHE	CF,
Me	Me	H	H	1	H	H	E.Me	NEt2	CF.
Me	Me	H	В	1	H	11	S.Me	NHPb	CF ₃
Me	like:	Ħ	H	l	И	H	SMo	N(Me)Ph	ĈF,

[0151]

【表110】

(119)

235

特闘2002-308857

236

R'	\mathbb{R}^2	Rª	R.	n	R ⁶	R⁵	R ⁴¹	R ⁴⁷	R N
Me	Me	H	H	L	A	н	SMe	CN	CF ₃
Me	Me	н	H	1	H	H	80₂Me	F	CF ₃
Me	Me	H	H	į	Θ	H	SOzhie	C)	CF ₃
Me	Me	н	И	ι	8	н	SO ₂ Me	OH	CF ₃
Me	Me	H	II	ı	0	11	SO₃Me	OMe	CF ₂
Me	Me	н	H	ı	B	Н	SO ₂ Mic	OBt	CF ₃
Me	Me	H	H	ι	B	н	SO ₂ Me	OPr−i	CP3
Me	Me	H	H	1	H	н	8O₂Me	OPr	CF ₃
Me	Me	H	Ħ	ı	Я	н	SO, Me	OBu•t	CF:
M+	Me	H	H	1	Ħ	н	SO_Me	OCH₂Pr-c	CF _a
Me	Me	H	H	1	H	н	SO ₂ Me	OCH ₂ Burc	CF ₃
Me	Me	н	И	ı	Н	н	SO ₂ Me	OCIf Penre	CF,
Me	Me	н	н	ι	U	11	80⁵We	OCH ₂ Hex-c	CF ₃
Me	Me	н	Н	1	Н	н	SO _z Me	OPenc	CP ₀
Me	Me	н	H	ı	A	н	SO ₂ Me	Offere	CF _s
Me	Me	н	H	ı	A	Н	80 _k Me	OCH,Ph	CP _B
Me	Me	н	H	ï	Θ	Н	SO ₂ Me	OPh	CP ₃
Me	Me	н	Ħ	1	H	н	SO ₂ Me	ochp,	CF _n
Me	Me	н	H	i	H	н	80 _z Mo	នុអ	CF ₃
Me	Me	H	Ħ	ı	Н	H	SO ₂ Me	SMe	CF _z
Me	Me	11	H	ī	H	Н	SOzMe	SO,Me	CP _s
Me	Me	H	Н	"	ë	н	SO ₂ Me	SEt	CP _a
Me	Me	11	H	انا	H	H	SO ₂ Me	SO ₂ Et	CP ₃
Me	Me	H	H	i	8	H	SO₂Me	SPri	CF ₀
Me	Me	н	H	î	н	К	SO Me	SO ₂ Pri	CF ₈
Me	Me	н	H	1	H	н	SO2Me	SPh	CF _x
Me	Me	11	11	î	13	H	SOMe	SO,Ph	CF _n
Me	Me	н	H	ī	н	н	80 ₂ Me	SCHF2	CP,
Me	Me	н	H	î	н	и	SO ₂ Me	SO ₂ CHF ₂	CF,
Me	Mo	н	H	Ÿ	A	н	SO ₂ Me	NH _a	CF ₂
Me	Me	н	H	1	н	н	SO ₂ Me	NHMe	CP ₃
Me	Me	H	ы	1	l·I	H	SO _k Me	NMe,	CF,
Me	Me	н	н	1	н	н	SO ₂ Me	NHE	CF ₂
Me	Me	н))	ì	н	н	SO _z Me	NEt.	CF.
Me	Me	н	11	ï	(1	EL	SO _c Me	MUPh	CIF ₀
Ме	Me	H	H	ı	н	Fi	SO ₂ Me	N(Mc)Ph	CF,
Me	Me	н	33	ì	н	Н	SO₂Me	CN	CF ₃
Me	Me	н	н	i	н	H	NH ₂	F	CF ₅
Me	Me	н	34	1	FI	н	NH.	Cl	CF ₃
Me	Me	н	H	1	н	H	NH ₂	OH	CF ₂
Me	Me	н	H	i	H	H	NH ₂	OMe	CF8
Me	Me	н	H	ï	н	н	NH.	OEt	CP,
Me	R4e	11	H	ı	H	H	NH ₂	Ofr-i	CF ₃
Mc	Me	Н	H	ı	H	H	NH:	OPr	CF ₃
Me	Me	H	H	ı	Н	н	NH.	OBurt	CF ₃
Me	Me	H	и	ì	H	и	NH ₂	OCH ₂ Pmc	CP ₂

[0152]

【表111】

(120)

特閱2002-308857

238

RI	R2	R ³	R4	J2	R ^a	Rª	R41	R ⁴⁸	E43
Me	Me	Ħ	H	1	H	El	NII2	OCH _t Bure	CF.
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	OCH2Pente	CF ₃
Me	Me	H	н	1	(i	H	NH ₂	OCH.Hexre	CF,
Мe	Me	H	H	ı	Н	14	NH ₂	OPent	CF ₀
Me	Me	H	H	į	н	н	NH3	Oliex-c	CF _n
Me	Me	H	11	ı	H	H	NH ₂	OCH,Pb	CF _s
Me	Me	H	lí	l	H	н	NH ₂	OPh	CF ₀
Me	Me	H	H	i	H	н	NH,	OCHF ₂	CF,
Me	Me	B	H	ı	H	H	NH,	SH	CF _s
Me	Me	H	Н	ı.	н	H	MH.	SMe	CF ₄
Me	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	SO _x Me	CF ₃
Ma	Me	H	Н	ı	H	H	NH,	Set	CF ₅
Me	Ma	H	H	ι	H ,	Ħ	, H4	SO₂Et	CP.
Me	Me	19	H	Ł	Н	Н	NH:	SP _{Y'} i	CF,
Mte	Me	H	н	ì	H	H	NH ₃	SO ₂ Pr-i	CF ₃
Me	Mo	H	H	i	н	H	NH,	SPb	CF.
Me	Me	H	H	ı	H	13	NH3	SO ₂ Ph	CF,
Me	Me	H	H	1	H	II I	NIJa	SCHF ₂	CF;
Me	Me	14	14	1	н	H	NH ₂	SO ₂ CHF ₂	CF.
Me	ble	H	H	1	ĸ	H	NH,	₽.H°	CF:
Me	Ma	н	H	1	Н	H	.HK.	· NHMe	CF,
Me	Me	H	H	1	H	Ħ	NH ₂	NMes	CP ₁
Mo	Me	H	H	1	H	H	NH3	NIEŁ	CF ₃
D-lice	Me	H	H	1	H	H	NH ₂	NEt _z	CF3
Me	Me	н	H	1	H	н	NH2	NHPh	CF,
Me	Me	Н	H	1	H	H	NH ₂	N(Me)Ph	CF ₃
Ne	Me	н	H	1	H	H	NH ₂	CN	CF.
H	H	H	н	1	H	H	н	OM _e	CF,
н	13	H	Н	1	н	H	Н	OEt	CF,
Me	H	H	H	ŧ	н	H	н	OMe	CF,
Me	H	H	H	Ĺ	IJ.	H	Н	OEı	CF ₃
≤	H	Me	H	I	II	H	H	OMe	CF ₃
Me	H	Me	H	1	Н	H	H	06t	CF ₃
Mo	Me	H	H	1	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	Ħ	В	1	Me	H	H	OBt	CF.
Me	Mo	H	B	1	Et E	H	El .	OMe	CF.
Me	Me	И	H	1	Et	H	U	OFA H	CF ₃
lite:	Me	Н И	H	1	Pri	H H	H	OW ⁶	CF ₃
Me	Me		B	l 1	Pri Pri	H	H	OEL	CF ₂
Me Me	Ме Ме	H H	H	1	Mie	Мe	H	OMe	CF ₃
Me	Me	Н	H	1	Me	Me	H	OEt	CF's
Me	Me Et	н	9	1	H	H	H	OMe	CF,
Me	Et	В	H	1	H	H	H	ORi	CF,
Bt	Et	B	10	1	H	Н	H H	QMe	CF ₀
Et.	Et	H	H	,	н	H	H	OEt	CF ₃
Cit.	Et	ח	<u> </u>	<u>, , </u>	Щ.	<u> </u>	17	VEL	UFS

【表112】

[0153]

237

(121)

239

特闘2002-308857

240

Ri	\mathbb{R}^2	R'	R4	12	Rº.	R*	R41	R*2	R*3
Me	Pei	H	H	1	B	ĥ	H	OMe	CF ₃
Me	Pri	Н	li	1	H	H	н	OBc	CF,
Me	l Py	н	Н	ı	H	H	H	OMe	CF _a
Me	Pr	н	н	lî	H	н	н	OEt	CF.
Me	Proc	н	H	1	н	п	ii	OMe	CF.
Me	Pre	H	Н	i	н	н	H	OEt	CF,
Me	CH ₂ Pr-c		គ	li	H H	H	н	OMe	CF ₃
Me	CH Pre		H	ĥ	н	н	ที	OEt	
	H2);	H	H	i	H	H	ł .	OMe	CF ₃
		H	H	i	H	H	H		CF,
	H-)'-	H	H	1 -		#	H	OBL	CF ₃
			ľ	1	Н		H	OMe	CF4
	H ₂),	H	H	1	Н	Ħ	H	OEt	CF ₂
	H)¹.	H	H	1	H	11	H	OMe	CF,
	H ₂),-	Ħ	H	1	Н	H	13	ORt	CF ₃
1 30	H ⁹ /2-	H	н	L	H	H	H	OMe	CF,
	H)4-	Ħ	H	ı	H	H	U	OEt	CP ₃
H	-(CH;	/3"	B	1	Н	H	Н	CM€	CF ₂
н	-œu,	s	H	1	н	H	Ħ	OEt	CF,
H	·(CH,),-	Н	1	н	Ħ	H	€ CiMe	CF ₃
H	·(CH,),•	Н	l.	Ħ	H	H	O Et	CF,
भ	«СИ,)5-	Н	1	11	H	H	OM#	CF ₄
н	·(CH,)5-	H	1	H	H	н	OEt	CF ₂
н	·(CH,) ^a -	н	1	H	u	Ħ	OMe	CP,
н	CH,		H	1	H	H	H	OEt ,	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	Ħ	H	CI	C1
Me Mo	Me Me	H	H	9	H	II.	H	ОН	g
Me	Me	Ĥ.	H	0	H	H	H	OMe O©t	려
Me	Me	н	Ĥ	ŏ	Ж	Ĥ	Ř	OPr-i	ď
Me	Me	н	Ħ	0	11	н	H	OPr	Ci
Me	Me	H	н	0	Н	Н	н	OBu-t	C1
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OCH ₂ Prc	Ci
Me	Me	Н	H	9	Н	н	H	OCH ₂ Bu-c	C1
Me	Me	11	벍	0	Н	H	н	OCH ₂ Penre	C1
Me	Me	H	H	0	ы	H	H	OCH2Hexte	Cl
Me Mc	Me Me	H	H	0	H	H	H	OPen'c	Cl
Me	Me	н	н	o o	H	H	H	OHexic OCH ₂ Ph	CI
Me	Ne	н	it	ő	н	'n.	H	OPh OPh	CI
Me	Me	н	Н	ò	Н	H	Ĥ	OCHF,	a
Me	Me	н	Н	0	H	Ħ	н	SH	Ci
Me	Me	H	H	0	H	H	н	8Me	CI
Me	Me	H	H	O.	H	H	H	SO ₂ Me	Cl
Me	Me	H	H	0	H	H	Ж	SEt	Cl
Me	Me	Н	н	0	Н	H	H	SO,Et	Ci
Me	Me Me	H	H	0	Ħ	H	11 H	SPr-i	CI
Me	Me	н	H	0	A	н	H	SO ₂ Pr-1 SPh	Cl Cl
Me	Ma	H	H	ő	8	Н	H	SO ₃ Ph	ci

[0154]

【表113】

(122)

241

特闘2002-308857

242

R'	R2	Rª	R*	n	R ⁶	R"	R4'	R+3	R*5
Mo	Me	H	H	0	Н	IJ	H	SCHF,	Cl
Me	Me	н	33	6	н	H	н	SO,CHP.	Ci
Mo	Me	H	н	0	Н	A	н	NH.	Cl
Me	Me	H	H	ŏ	H	И	H	NHMe	Ċì
Mo	Me	H	II.	o	H	Ħ	н	NMet	či
Me	Me	н	H	ŏ	H	(1	H	зани	ÇI
Ma	Me	н	H	Ü	Ĥ	H	Ĥ	NEt.	či
Me	Me	H	н	o	н	H	H	NHPh	Či
M ₉	Me	H	33	ŏ	Ĥ	н	Ĥ	N(Me)Ph	ä
Me	Me	н	н	ŏ	н	ii	Ĥ	CN	ä
Me	Мp	H	н	Ó	н	H	H	F	Ma
Me	Mε	H	H	0	Н	Н	H	Cl	Ma
Me	Мы	H	H	0	H	H	н	OH	Me
Me	Ma	H	H	ŋ	H	H	H	OMe	Me
Me	Mc Me	H	14 14	0	H	H	H	Olit OPri	Me
Me Me	Me Me	H	H	0	li	Н	H	OPr	Me Me
Me	Me	Ĥ	н	ő	8	ñ	H	OBu-t	Mc
Me	Me	H	ਮੌ	ő	Ä	H	Ħ	OCH ₂ Pre	Me
Me	Me	н	Н	ŏ	Н	H	H	OCH ₂ Bure	Me
Me	Me	н	н	ŏ	H	H	11	OCH ₂ Pee-t	Mo
Me	Mic	H	н	Q	H	Ħ	H	OCH, Hexe	Me
M∈	Me Me	H	H	0	H	H .	H H	OPen-c OHex-c	Me Me
Me Me	Me	H	H	0	Н	H2	H	OCH _z Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	II	H	OPh	Me
Me	Me	ä	11	ŏ	Н	H	н	OCHE,	Me
Me	Me	H	н	0	Н	EĪ	H	38	Me
Me	Me	Ĥ	H	ŏ	н	н	н	SMe	Me
Me	Me	н	н	ŏ	Н	K	н	SU ₂ Me	Ме
Me	Mo	Й	Н	0	н	H	[-]	SE1	Me
Me	Me	н	H	ō	Н	H	H	SO ₂ Et	Мо
Me	Me	Ħ	H	6	Н	н	Н	6Pr-i	Me
Me	Me	н	Н	Ü	ĮΗ	н	н	SO ₂ Pr-i	34 60
Me	Me	н	н	0	Fl	н	Н	SPh	Me
Me	Me	н	н	0	H	H	H	SO ₂ Ph	Me
Me	Me	II	Н	0	H	Ħ	н	SCHF ₅	Me
&Te	Me	н	Н	ő	Ж	И	ห	SO ₂ CHF ₂	Me
Me	Me	н	н	ŏ	H	н	เเ	NH ₂	Me.
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Me
Me	Me	H	H	ŏ	H	H	H	NMe,	Me
Me	l-Te	H	H	ő	H	H	H	NHE:	Me
Me	Me	Ħ	H	ŏ	H	й	Н	NEs.	Me
Me	Me	H	н	ŏ	H	H	н	NHPh	Me
Me	Me	H	НĤ	ő	H	H	н	N(Me)Ph	Me
Me	Me	H	H	0	H	H	н	CNi	Me
Me	Me	н	H	Ò	H	16	H	F	P≁i
Me	Me	н	Н	0	H	н	H	C1	Pri
Me	Me	H	H	9	H	H	H	OH	Pri
Me Me	Me	H	H	0	H	H	H H	OMe OEt	Pri Pri
Me	Me	н	Ä	6	Ж	H	ที	OPy-i	Pri
Me	Me	ĺй	H	5	н̈́	H	ŧi	OPr	Pri

[0155]

【表114】

(123)

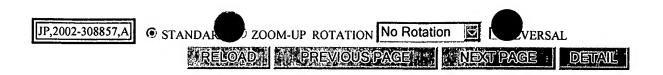
243

特闘2002-308857

244

R'	R²	R ^a	R ⁴	_	R ⁵	R	R ⁴¹	R ⁴⁸	R ⁺⁸
Me	Me	Н	H	0	H	Н	H	OBu-t	Pr
Me	Me	H	н	ŏ	н	E	II	OCH ₂ Pre	Fri
Me	Me	H	н	0	н	H	н		
								OCH ₂ Bure	Pri
Me	Me	Ħ	Н	0	H	H	н	OCH Pen-c	Pri
Me	Me	H	н	٥	н	н	Н	OCH ₂ Hex-c	Pri
Me	Me	H	H	0	Н	H	H	OPen·c	Fri
Me	Me	H	H	0	H	H	H	OHexic	Prı
Mo	Me	H	H	D	н	H	H	OCH ₂ Ph	Pyra
Me	Me	н	H	0	H	H	H	OPh	Px-1
Me	Me	H	H	0	H	H	н	OCHF,	Pri
Me	Me	H	H	0	H	K	H	SH	Pri
Me Me	Me Me	H	H H	0	H	H	H	SMe	Pri
Me	Me	H		ő	H	н	н	SO,Me SEt	Pr
Me	Me	Н	H	ő	Н	Н	H	1	Pri
Me	ede Ede		11				H	SO _z Et EPrei	Pri
		H		0	11	H			Pı-ı
Me	Me	H	H	0	H	H	H	SO ₂ Pr-:	Pr
Me	Me	н	H	0	H	H	H	SPh	Prı
Me	MB	Ħ	H	0	H	H	н	SO₂Ph	Pri
Me	Mr	Ħ	H	0	H	11	ij	SCHP ₂	Pres
Me	Me	Н	H	G i	Н	H	н	SO,CHF,	Pri
Me	Me	H	H	0	H	H	н	NH2	Peri
Me	Mc	R	H	0	Ħ	H	н	NHMe	Pri
Me	Me	H	H	0	A	H	H	NMe _x	Pr−i
P.4e	Me	H	H	0	A	H	H	NHEt	Per
Me	Me	н	н	0	ti	11	н	NE42	Pr-1
Me	Me	В	И	0	Н	H	н	NHPh	Prı
Me	Me	H	и	0	H	H	Н	N(Me)Ph	Pri
Me	Me	H	H	G	H	H	H	CN	Pri
Me	Mê	H	H	C	H	H	H	F	Pre
M≥ Me	Me Me	H	Н Н	0	H	H	19 19	C! OH	Pr-c Pr-c
Me	Me	片	н	ŏ	H	B	R	OMe	Pro
Ma	Me	н	H	ŏ	H	ë	13	OEL	Pe-c
Me	Me	H	Ĥ	ŏ	H	Ä	н	Offici	Proc
Me	Me	н	H	o	H	H	н	OPr	Pr-c
Me	Mc	H	H	0	Н	H	H	OBurt	Proc
Me	Mc	Н	H	٥	H	Ð	H	OCH ₂ Prrc	Pr-c
146	Me	H	H	e	H	B	H	OCH ₂ Bure	Pr-e
Me	Me	l-i	н	C	4	អ	н	OCH Penc	Pr-c
Me	₹√Te	ea.	Н	٥	н	8	н	OCH Hex-c	Pre
Me	Me	Ĥ	н	ò	н	Ä	н	OPento	Pro
Me	Mo	H	Н	ò	Н	H	H	OHex-a	Pre
Me	Me	H	H	0	Н	H	Н	осн,рь	Pr-c
Me	?die	н	H	Q.	H	H	Н	OPh	Pre
Me	Me	អ	н	0	H	H	H	OCHF,	Prc
Me	hie	н	н	0	H	Ш	н	SH	Pre
Me	Me	H	H	Û	H	Ħ	Н	SMe	Pr-c
Me	Me	н	ਸ	0	H	H	Į-1	SO ₂ M ₂	Pre
Me	Mc	H	Н	0	н	н	11	SEt	Pre
Me	Me	H	н	0	H	Н	н	SO₂Et	Pre
Me	Me	И	Н	0	H	H	Н	SPru	Perc

[0156] [表115]



(124)

245

特闘2002-308857

246

		1 -1		_					
R ¹	R²	R ³	R4	72	R3	R*	R41	R ⁴²	R13
Me Me	Me Me	H	H	0	n	H	Н	60 ₂ Pr-i	Proc
Me	Me	H	H	9	H	H	H	SPh	Pre
Me	4				H	H	Н Н	SO ₂ Ph	Pe-c
1	Me	Н	\$1	0	H	H	н	SCHF ₂	Pr-o
Me	Me	H	H	0	Ħ	п	Н	Soichli	Pro
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NH ₂	Pro
Me Mc	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	Pre
Me	Me Me	H	H	9	H	H	H	NIMe ₂	Pre
Me	Me	a	H,	0	Н	H	H	NHEL	Pro
Me	Me	Ĥ	В	ŏ	H	H	H	NEt; NHPh	Pr-e Pr-e
Me	Me	e	H	ŏ	Ĥ	н	H	N(Ma)Pb	Pre
Me	Me	Ĥ	H	ŏ	îì	II	H	CN	Pre
Me	Me	n	E	0	H	Н	н	Į.	CHF,
Me	Me	H	Ð	0	ŀί	н	H	CI	CHF.
Me	Me	H	H	0	H	н	H	CH	CHF
Me	Me	H	н	U	Н	н	Ħ	OMe	CHF.
Me	Me	н	Н	0	н	н	H	OE1	CHF ₂
Me	Me	н	H	0	H	н	A	OPr-i	CHF,
Me	Mo	H	н	0	14	ਮ	н	OFr	CHF:
Me	Me	н	Н	0	н	н	H	OBurt	CHF.
Me	Me	ਜ	н	0	п	II	e)i	OCHLPre	CHF ₂
Me	b1e	H	H	0	н	Н	н	OCH ₂ Bure	CHFB
Me	Me	11	A	Ð	н	н	н	OCH ₂ Penre	CHF.
Me	Me	н	Н	9	н	Ħ	H	OCHellex e	CHP ₂
Me	Me	н	H	0	H	н	н	OPen c	CHPa
Me	Mo	11	н	0 1	H	н	н	OHexic	CHF.
Me	Me	H	н	0	J 4	H	H	OCH,Ph	CHF
Me	Me	н	н	0	Н	н	н	OPh	CHF.
Me	Me	H	н	0	н	н	н	OCHF.	CHF.
Ma	Me	н	}-[0	н	н	н	SH	CHF,
Me	Me	я	н	ō	Н	н	н	SMe	CHF ₂
Me	Me	н	Ĥ	9	н	н	H	SO Me	CHE
Mo	Me	H	H	6	н	н	н	SEt	CHF2
Me	Me	ii l	н	ŏ	н	H	н	SO ₂ Ei	CHF ₂
Me	Me	н	н	ŏ	H	н	н	SPri	CHP _e
Me	Me	н	н	0	н	н	н	SO ₂ Pri	CHF ₂
Mo	Me	Н	м	ő	н	н	H	SPh	CHF
Me	Me	н	н	ő	н	н	н	SO.Ph	CHF
Me	Me	н	H	ŏ	н	H	н	SCHF.	CHF2
Me	Me	н	н	ō	Ĥ	H	н	SO CHP	CHIL8
f∕le	Me	н	н	č	н	H	н	NH ₂	CHE.
Me	Me	н	н	ō	н	Ж	н	NHMe	CHE2
Me	Me	н	н	é	В	H	H	NMe ₂	CHE
Me	Mo	н	н	Ü	H	и	14	NHE	CHF:
Me	Mc	н	Н	0	H	H	н	NEG	CHF ₂
Me	Me	и	н	o	H	H	н	NHPh	CHF ₂
Me	Me	Ĥ	н	Ü	0	H	н	NiMe)Ph	CHF ₂
1.16	2415	للننا	-11	- 4	,	• •	1.5	(AIDIGAL)	OFIES

[0157]

【表116】

(125)

247

特闘2002-308857

248

ſ		_ ^ _						-31	- 42	61	
ļ	R'	R ²	R*	R'	n	R ⁶	P.	R ⁴¹	R ⁴²	K _{tl}	
-	Me	Me	H	H	0	8	H	H	CN	CHF.	
1	Me	Me	H	19	0	H	H	ਮ	F	CF ₃	l
	Me	Me	H	Н	0	8	EI	H	Ç1	CF,	ĺ
	Me	Me	Н	H	0	H	H	н	OII	CP _a	ĺ
	Me	Me	H	H	0	B	H	H	OMc	CF ₂	l
١	Me	Me	н	н	0	H	El	Н	OEè	CP3	l
	Me	Me	H	H	Ü	H	Н	Ħ	OPri	CF ₃	l
ı	Me	Mc	H	Ж	0	H	н	н	OPr	CF ₃	l
1	Me	Me	H	н	٥	H	H	н	OBu-t	CF3	l
1	Me	Me	H	H	٥	H	н	Н	OCH ₂ Pr-c	CE.	l
ł	Me	Ma	н	H	0	H	H	H	OCH2Burc	CF ₅	l
1	Me	Me	н	H	Û	Ħ	H	H	OCH ₂ Penre	CF8	l
1	Me	Mε	H	Н	0	H	H	H	OCH2Hex-c	CF,	l
1	Me	Me	H	H	0	Н	H	H	OPenic	CFa	l
1	Me	Me	H	н	0	6- 1	н	И	OHex-c	CF ₃	l
١	Me	Me	H	H	0	FI	14	H	OCH,Pb	CF.	l
ı	Me	Me	H	H	Û	H	H	H	OPh	CF ₃	l
ı	Me	Me	H	H	0	н	H	H	OCHF:	CF,	l
1	Me	Me	H	H	G	н	н	H	SH	CF _a	l
1	Me	Me	H	H	G	H	Ħ	FJ	SMe	CF,	l
Į	Me	Mo	H	Н	0	H	H	H	SO,Me	CF ₃	l
Į	Me	Me	н	н	0	Н	н	H	SEt	CF ₃	l
ı	Me	Me	H	H	0	H	н	(-)	SO₂Et	CF ₈	ĺ
ı	Me	Me	H	Ħ	G	H	н	Н	SPr-i	CF,	
ı	Mis	Me	н	H.	G.	Ħ	н	н	SO ₂ Pr-i	CF ₃	l
ı	Me	Me	H	Ħ	0	H	н	н	SPh	CF3	
ı	ble	Me	н	н	0	H	н	Ħ	SO₃Pa	CF,	
Į	Me	Me	н	н	Ü	H	H	H	SCHF.	CF ₂	
ļ	Me	Me	н	н	0	H	H	Н	SO2CHF2	CF,	ĺ
1	Me	Me	н	H	0	H	н	Н	NH ₂	CF,	l
١	Me	Жe	Ħ	H	0	H	н	H	NHMo	CF,	l
Į	Me	Me	н	Ж	0	H	н	Ħ	NMe,	CF _s	l
-	Me	Me	н	н	0	H	н	Ħ	NHE	OF₃	l
١	Me	Me	н	н	0	H	H	н	NEta	CF ₂	ĺ
1	Me	Me	н	н	0	H	H	н	NHPh	CF3	l
1	B to	Me	H	н	0	н	и:	н	N(Me)Ph	CF.	l
1	Ne	Me	н	н	0	Hi	H	н	CN	CP3	ĺ
	Me	Me	H	H	9	H	H	Н	F	OMe	l
	Me	Me	H	H	0	H	H	H	OH	OM _b	l
	Me Me	Me Me	H	H	0	H	H	H H	OMe OBt	OMe OMe	l
	Me	Me	H	Н	ő	н	l H	н	OPr-i	OMe	l
	Me	Me	H	H	Ó	H	H	н	OP _x	OMe	١
1	Mo	Me	Н	ii	0	Н	н	H	ORest	ОМе	l
	Lite	Me	Н	н	0	Н	H	OI .	OCH ₂ Prrc	OMe	l
	Me	Me	H	H	0	Н	Н	H	OCH ₂ Bure		١
1	Me	λla	Н	Ð	0	H	H	8	OCH,Pen-c		۱
	Me	Me	H	႘	0	H	H	H	OCH, Hex-c	OMe	۱

[0158] 【数117】

(126)

249

特闘2002-308857

250

R'	R²	Rª	R*	Ū	R"	RA	K41	R*?	R ^{gt}
Me	Me	H	H	0	1)	EH	H	Oren-c	OMe
Me	Me	H	н	C	н	Ħ	ŀΙ	OHex-c	OMc
Me	Me	H	H	6	н	н	H	OCH,Ph	OMo
Me	Me	н	и	Ü	H	н	н	OPh	OMe
Me	Me	Н	н	٥	H	H	H	OCHF ₂	OMe
Ma	Me	н	н	0	(·I	ĸ	н	SH	QMu
Ma	Me	H	н	ō	[-]	H	H	SMa	UMe
Me	Me	н	н	Ū	H	H	H	SO ₂ Me	UMe
Me	Me	н	н	0	H	H	H	SEt	ÚMo
Me	Mic	Н	H	o	н	н	[-]	80 ₂ Et	OMe
Me	Me	нI	H	Ø	H	H	H)	SP ₁ -i	OMe
Me	Mue	н	11	i i	H	H	H	SO ₂ Pri	DMe
Me	Me	н	H	6	H	н	н	SPh	UMe
Me	Me	н	н	Ó	H	н	H	SO ₂ Ph	UMe
Me	Me	н	н	o	H	H	н	SCHP	OMe
Me	Me	Н	н	0	H	Н	H	SO, CHF,	OMe
							н	NH ₂	OMe
trae	Me	빘	H	0	H	Ħ		NHMe	OMe
Me	Me	H	н	0	Įį.	H	H		
Me	Mo	H	H	0	H	H		NMe ₃	OMe
Me	N1e	H	н	8	И	H	H	NHEt	OMe OMe
Me	Me	ij	11	0	H	H		NEG	OMe
Me	Me Me	H	H	0	H	H	II H	NHPh N(Me)Ph	OMe
Me	Me	Н	H	0	H	17	H	CN	OMe
Me	hie	H	H	0	H	뇄	H	F	OPh
Me	Me	ii	H	ő	н	Ĥ	H	он	OPh
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	Ĥ	OMe	OPh
Me	Me	н	Ĥ	0	H	H	Ĥ	OEt	OPb
Me	Me	н	ŀΙ	0	H	н	Н	OPr∙i	OPb
Me	Me	H	11	0	H	Ħ	H	OPr	OPb
Me	№e	H	H	0	H	H	H	OBu-t	OPh
Me	Me	Ħ	H	O.	H	H	H	OCH ₂ Pr·c	OPh
Mo	Mc	H	H	0	н	H	e	OCH ₂ Bu-e	OPla
Me	Me	н	Ł1	0	'н '	H	01	GCH ₂ Penc	OPh
Ma	Me	н	H	0	н	н	ea ea	OCtl.Hex.c	OPh
Me	Me	н	H	0	H	н	19	OPen'c	OPb
14e	Me	H	H	0	Ж	Н	H	ОНеятс	OPh
Me	Me	н	H	C	H	н	H	OCH,Ph	OPh
Me	Me	н	IJ	0	Н	H	а	OPh	OSF
Me	Me	н	н	0	н	и	H	OCHT,	OPh
Me	Me	H	Ħ	0	н	H	Ħ	SH	OPh
Me	Me	н	H	0	и	н	H	SMe	OPh
Me	Me	Ħ	H	0	H	н	Н	SO ₂ Me	OPh
Me	Me	H	H	0	н	H	H	SEt	OPb
lde	Me	H	H	0	н	н	H	SC ₂ Et	OPh
Tubes	Me	Н	H	0	н	H	H	SPr-i	OPh
Mc	Vie	H	н	0	н	Н	H	SO _t Pri	OPh.
Me	Мe	Н	11	0	н	Н	¥ſ	SPh	OPh
Me	Me	н	H	ō	н	17	Ħ	80 ₉ Ph	OPh
Me	Мe	H	H	0	H	H	H	SCHF,	OPh
Ma	<u>M</u> e	н	н	0	н	H	H	SOGCHE	ОЪР
Me	Me	H	H	n	н	Н	н	NH ₃	OPh

[0159] [表118]

2/16/2005

(127)

251

特闘2002-308857

252

R'	R ^s	R3	R4	n	R"	R ^e	R ⁴¹	R ⁴²	R ^{es}
Me	Me	1-1	14	Ü	Ĥ	ਸ	H	NHMe	OPh
Me	Me	H	н	0	H	н	H	NAter	OPh
Me	Me	H	Н	0	H	H	H	NHEL	OPh
Me	Me	Н	H	0	н	H	H	NE ₁₂	OPh
Me	Me Me	H	H	0	H	Н	H	NHPh N(Me)Ph	OPh OPh
Me Me	Me	H	H	0	л !!	H	H !!	CN	OPh
Me	Me	н	н	o	Ĥ	H	H	F	OCHF.
Mo	Me	H	13	0	H	в	н	OH	OCHE
Me	Me	н	H	0	Н	н	н	O Me	OCHE.
Me	Ma	н	н	0	£1	41	11	OEt	OCHE.
Me	Me	н	н	0	н	н	H	OPr-i	OCHE
Mo	Me	н	н	0	н	н	н	OPT	OCHF.
Me	Me	H	н	0	н	н	н	Dfort	OCHE
Mo	Me	н	н	0	Н	H	н	OCH _z Pr-c	OCHF.
Me	Me	н	н	0	H	н	н	OCH.Burc	OCHE.
Me	Me	н	н	0	н	в	н	OCH Penc	OCHE,
Me	Me	н	н	0	н	н	н	OCH Hex-c	OCHE2
Me	Me	н	н	0	н	н	н	OPen'c	OCHF2
Mc	Me	H	Н	٥	н	H	н	ОНек∙с	OCHF:
Me	Me	н	H	٥	Н	Ħ	H	OCH,Ph	OCHF.
Me	Me	H	H	0	ਸ	н	Ħ	OPh	OCHE,
Мe	Μe	Н	н	0	н	A	H	OCHF2	OCHF _z
Ме	Me	н	11	0	Н	н	н	SH	OCHP.
Me	Me	H	H	0	н	H	H	SMe	OCHP
Me	Me	H	H	0	н	Ħ	H	\$O ₂ Me	OCHE,
Me	Me	Ł1	H	0	H	Ħ	H	SEt	OCHF:
Me	Me	H	H	0	н	H	н	SO ₂ El	OCHF2
Me	Me	н	H	0	н	Ð	H	SPr-i	OCHF,
Me	Me	H	н	0	н	Ħ	н	SO ₂ Pri	OCHF _t
Me	Me	И	H	0	H	Н	H	SPh	OCHP ₂
Me	Me	H	н	0	H	H	н	SO₂Ph	OCHF:
Me	Me	H	H	٥	H	H	H	SCHF ₂	OCHP ₂
Me	Me	iì	H	0	Н	H	н	SO, CHP.	OCHF,
Me	Me	H	H	Û	Н	H	H	NH,	OCHF,
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NHMe	OCHF2
Me	Me	H	H	0	H	H	H	NMe ₁	OCHF:
Me Me	Me Me	8	E.	0	н	H	н	NHEt	OCHE
Me	Me	11	II.	0	II.	H	LL LL	NEC ₂ NILPh	OCHF ₂
Me	Me	H	H	0	H	й	Н	N(Me)Ph	OCHP ₂
Me	Mo	8	H	0	Н	H	H	CN	OCHF ₁
Me	Me	H	H	G	н	н	Me	F	CF
Me	Me	н	H	o	н	H	Me	l ċı	CF3
Me	Me	н	ex	ľ	н	H	Me	ОН	CF.
Me	Me	H	H	ŏ	н	H	Me	OMe	CF,
Me	Me	H	H	0	н	Н	Me	OEt	CP ₃

[0160]

【表119】

(128)

253

特闘2002-308857

254

R'	R³	Ŀ	R1	12	R ⁵	\mathbb{R}^{G}	$\mathbb{R}^{4!}$	R*8	R ⁴³
Mo	Me	H	H	0	H	H	Mo	OPe-i	CP,
Me	Me	Ħ	Ħ	6	H	Ð	Me	OP _r	CF ₃
Me	Me	H	Н	0	H	н	Me	OBurt	CF,
Me	Me	H	н	0	н	и	Me	OCH ₂ Pre	CF;
Me	Me	н	H	0	(·I	K	Mo	OCH₂Bu-c	CF.
Me	Me	H	H	0	H	H	Me	OCH, Pente	CF,
Me	Me	н	н	Ü	H	H	Me	OCH, Hexec	CF ₂
Me	Me	Н	Н	0	H	н	Ma	OPenc	CF ₃
Me	Me	н	н	0	H	H	Me	Offexic	CF _a
Me	Me	Н	н	0	Ħ	H	Mo	OCH ₂ Ph	CF,
Me	Me	H	н	0	Н	Ħ	Me	OPh	CF,
Me	Me	н	11	e	Н	H	Me	OCHF:	CF,
Me	Me	н	н	0	Ħ	Ħ	Me	SH	CF,
Me	Me.	В	H	0	H	H	Me	SMu	CF,
Me	Me	11	H	ø	н	н	Me	SO ₂ Me	CP ₀
Me	Me	H	Н	e	Ħ	н	Me	SEt	CF,
Me	Ma	H	H	0	H	н	Me	SO ₂ Et	CF ₅
Me	Me	н	Н	G.	Ħ	Ħ	Me	SPr-1	GF,
Mo	Me	H	H	0	H	н	Me	SO ₂ Pr-i	CF,
l-le	Me	н	11	0	H	H	Me	SPb	CP_4
ble	Me	Н	H	0	H	H	Me	SO _z Ph	CF,
Me	Me	Н	н	e	H	н	Me	SCHF ₂	CF ₃
Ma	Me	H)	Н	٥	H	Ħ	Me	SO ₃ CHF ₀	CF _s
Mo	Me	H	H	0	H	н	Me	NH ₂	CF4
Ms	Me	И	н	ŭ	н	н	Me	NHAle	CF:
Me	Me	н	H	٥	H	H	Me	NMc ₂	CF,
Me	Me	н	н	۵	H	H	Mo	NHE	CF _a
Me	M≎	H	Н	0	н	11	Me	NFA.	CF3
Ma	Me	Н	H	0	H	H	Me	NHPh	CP3
Me	Me	R	Н	0	H	H	Me	N(Me)Ph	CF3
Me	Me	H	II	0	Н	H	Me	CN.	CF,
Me	Me	н	H	0	н	Н	eMO.	F	CP,
Me	Me	н	H	Ů.	(i	11	OMe	ÇI	CF3
Me	Me	Н	14	0	Н	H	OMe	OH	CF3
Me	Me	Н	H	0	H	H	OMe	OMie	CF:
Me	Die	н	н	0	H	H	OMe	OEt	CF;
Me	Me	H	н	0	М	Н	OMo	OPrii	CF ₃
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OPr	CF,
Me	Me	Н	H	0	H	H	OMe OMe	OBu-L	CF;
Me	Me	H	H	0	H	H	OMe	OCH Pro	CF,
Me	Me	H	н	0	H	H	OMe	OCH _E Bure	CP)
Me	Me	Н	Н	0	. н	H	OMe	OCH ₂ Penre	CF,
Me	Me	H	H	0	H	H	oMe aMQ	OCH ₂ Hex-c	
Me	Me	H	9	Ü	H			OPenc	CF ₃
Mo	Me	11	H	0	H	H	OMe	OHex-c	CF ₃
Me	Me	н	H	0	н	Н	OMe	OCHEPA	CF ₂

[0161]

【表120】

(129)

255

特闘2002-308857

256

R¹	R ²	R ³	R ⁴	ń	R ⁵	Re	Ra	R 48	R
Me	Me	Ĥ	H	0	H	Н	OMe	OPh	CF,
Me	Me	Ħ	H	0	B	Ħ	OMc	O¢HF₂	CF,
Mo	Me	H	н	0	H	H	OMe	SH	CF,
Me	Me	н	н	Ð	н	H	OMe	8Me	CF ₈
Mа	Me	Н	н	0	H	н	OMe	SO, Me	CF,
Me	Me	н	н	0	H	લ	OMe	SEt	CF ₃
Me	Nie	Н	н	ŭ	Ħ	н	OMe	SO ₂ Et	CF.
Mc	Me	Н	11	U	H	н	OMe	SPri	CF,
Me	Me	н	31	0	н	н	OMe	SO ₃ Pr1	CP ₂
Me	Me	H	н	0	H	н	OMe	SPh	CP,
Me	Me	H	H	0	Ĥ	н	OMe	SO₂Ph	CF _a
Mė	Me	Н	H	0	H	Ħ	O.Me	SCHF ₂	CF ₃
Me	Me	Н	н	0	H	H	OMe	SO_CHF2	CF,
Me	Mo	H	Н	0	H	H	OM _*	NH ₂	CF3
Me	Me	H	II	ņ	н	н	OMe	NHMe	CF ₂
Me	Me	H	н	0	H	ĪĪ	OMe	NM22	CF,
Me	Me	н	H	0	H	H	OMe	NHEt	CF ₃
Me	Me	ਸ	н	Ð	H	Ħ	OMe	NEt _s	CF,
Mc	Me	Н	н	0	Н	н	OM.	NHPh	CF,
Me	Me	н	H	0	н	н	OMe	N(Me)Ph	CF;
Me	Me	H	H	0	H	H	OM ₀	ÇN	CF,
Me	Me	H	(·)	0	H	H	SMe	F	CF,
Me	Me	н	H	U	H	H	8Me	Cı	CF,
Me	Me	H	H	0	Н	H	SMe	ОН	CF,
Mo	Me	H	H	0	34	H	SMe	Olvie	CF,
Me	Me	Н	H	O	Н	H	ВМе	QE1	CF.
Me	Me	н	н	0	H	H	SMe	OPri	CF,
									CF3
									CF ₃
								-	
								-	
								-	
					t .				
				,		1 1	-		
						1 1			
	1				1				
	1		ı	ı					
				ı					
		8			1		1	-	
		•				1			CK.
	t				1		1		CF.
				1					CF.
ŧ								-	CF.
Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me Me M	<u>нниннинниннинниннинниннинниннинниннинни</u>	# # # # # # # # # # # # # # # # # # #	0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	H H H H H H H H H H H H H H	HEARTHRAHARARI	SMe SMe SMe SMe SMe SMe SMe SMe SMe SMc SMc SMc SMc SMc SMc SMc SMc SMc SMc	Ofr OBure OCH, Perre OCH, Perre OCH, Herre OPerre OHerre OCH, Ph OCH, SMe SO, Me SO, Pri SO, Pri SPh	CF ₅ CF ₆ CF ₇

[0162]

【表121】

(130)

257

特開2002-308857

258

R[≪] CF, R" \mathbb{R}^2 R Mo SMe SO,Ph Н SCHF₂ CF, Nie Me H H Ģ н H Shie SO,CHE, Me Н Н SMe CF, Nic н Me Me Н SMe NH_2 CF₂ ſ-ī Н NHMe н H SMe CF, Me Μo Me Me H Ħ Q H H SMe NMe, CP, Me Me Н H н H SMe NHEŁ CF₀ Н Н H SMe NEt. CP, Ma Me H 0 Me Н H Ģ H H SMe NHPh CF, Me Me Me Н **SMe** N(Me)Ph CF, Н Н Me Me H H SMe CN CF. Me н н υ Н н SO₂Me CF, Me Мe Н H Q H H $8\Omega_2 Me$ Cl CF. Μŧ Μē Μo H H Đ н Ħ \$Ü₂Me ОH CF. SO_2Me QMe CF, Me Μz И н Ç [-] H Н Н SO₂Me OEt CF₂ Me Me H H H Н SO₂Me CF₂ Μe Me Н H OPr2 н 16 0 Ħ EI SD_∠Me OPr CF₀ Me Me Mo Me H H 0 Н H 8Q_Mo ĐĐu∙L CF, OCH3Prc Н 8O₂Me OF, Me Me Н Н 0 Ħ CF5 SO₂Me Me Me Н H Û Н H OCH₂Bu-c Me SO₂Me OCH,Penc CF₂ Me Н 0 u Ħ SO_2Me OCH₂Hexrc CF, Me Me H OPenw Μe Me Н Н 0 Н Ħ SO₂Me CF₂ Me H H 0 [·I Н S()₂Me OHex-c CF, Me Μe Me Н H 0 н Н SO₂Me OCH,Pb CF3 H И H SOJMe OPh CF, Me MA н н $80_2 M_{\odot}$ OCHE, CF, Me Me Н Н H SO₈Me ϵ H CF, Me Me H Μ¢ H H 0 Н H SO₂Me SMe CF, Mo н H 0 н Н SU₂Me SO,Me CF3 Μe Me SEt. CF3 Н SO, Me Me Me Н H 0 H SO₂Et CF₃ Me Me Н H ō Н H SO₂Me Me Me SO₂Me SPr CF, SO,Me Me Me Н H Q Н H SO₂Pri CF3 Ma 64€ H Н H SO₂Me SPh CF, Me Me Н H Đ H H $S\Omega_2Me$ 80_3Ph CF, н H $$Q_2Me$ SCHF, CF2 Me Me Н н 0 11 11 $80_2 Me$ SO. CHP2 \mathbf{CF}_{3} Me Me Н П Me Мe Н H Û H H 80₂Me NH_2 CF, M9 Me Н H Đ Н н SO₂Me N(-) h.Le. CF, NMe₂ Ü н H \$O₂Me CF2 Me Me н H H н SÛ₂Me NHEL CF. Me Мe Н H ¢ NEt_2 H H SO₂Me CF, Me Me Н H O CF₄ н H Ð н H SO₂Me NHPh Me ſÆ

H

60₃Me

N(We)Ph

CF₃

[0163] [数122]

Me

(131)

259

特闘2002-308857

260

R'	R ²	R,	R ⁴	12	\mathbb{R}^3	R	R41	R ⁴⁸	R*3
Me	Me	H	н	0	14	Él	oM _s O2	CN	CF,
Me	Me	H	H	0	H	н	Nete	r	CF ₃
Me	Me	14	H	0	H	В	NH.	Cl	CF ₃
Me	Me	H	H	0	н	Н	Nli ₂	OH	CF ₃
Me	Me	H	H	Ð	H	Ħ	Niis	OMo	CF,
Me	Me	H	Н	0	H	H	NH ₂	ΟŒι	CF ₄
Me	Me	н	H	0	H	H	NH ₂	OPru	CF ₂
Me	Me	н	H	Đ	н	H	NH ²	OPr	CF3
.Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	QBu-t	CF,
Мe	Me	н	H	0	H	H	NH ₂	OCH _o Pr _' c	CF,
Me	Me	н	н	0	Н	H	NH.	OCH2Bu-c	CF ₃
Me	Me	II	11	0	[I	H	NH ₂	OCH ₂ Pen-r	CF ₄
Me	Me	н	H	0	H	H	NH ₂	OCH, Hexe	CF ₂
Me	Me	н	н	0	H	H	NH ₂	OPenro	CF ₄
Me	Me	H	H	0	H	H	NH ₂	OHexic.	CF ₃
Me	Me	H	H	Û	H	H	ИH.	OCH ₈ Pb	CF _a
Me	Me	14	И	0	H	Н	NH_2	OPh	CF ₀
Me	Me	ਸ	H	0	Ħ	K	NH2	OCHF:	CF,
Me	Me	н	н	0	H	Н	NH.	SH	CF,
Me	M₽	11	11	0	H	H	NH2	SMe	CF ₂
Me	Me	Ħ	И	G	н	н	NH.	SO ₂ Me	CF,
Me	Me	H	н	0	H	н	NH3	SEt	CF ₄
Me	Me	H	H	Ð	H	H	NH3	SO ₂ Rt.	CF ₄
Mc	Me	H	н	G	H	н	NH ₂	SPr-i	CF ₂
Mu	Me	н	14	G	H	М	NH ₃	SO ₃ Pr-i	CF ₅
Me	Me	н	H	0	H	Ħ	NHa	6Ph	CF ₁
Me	Me	H	14	e	H	H	NH₂	SO _z Ph	CF ₂
Me	Me	н	н	Ü	H	H	NII;	SCHPg	CF _a
Me	Me	н	н	6	Ħ	H	NH	SO ₂ CHF,	CF.
Me	¢ ľ v1	н	н	0	H	Н	NH.	NH ₂	CF ₂
Me	Me	II][G	н	H	NH ²	NHMe	CF ₄
Me	Mo	н	н	0	H	Н	NH;	NMe _x	CF,
Me	еM	H	н	0	H	H	NH2	NHET	CF ₄
Me	Me	н	н	0	H	н	NH.	NEt ₂	CF ₁
Me	Me	H	11	0	H	H	NH2	NHPh	CF ₁
Me	Me	H	H	0	H	H	NH.	N(Me)Ph	CF ₄
Me	Me	н	H	0	H	Н	MH,	CN	CP,
H	Θ	H	} {	G	H	H	Н	OMe	CF,
н	8	H	H	ø	H	H	н	NEL	CF ₃
Me	H	H	Н	0	H	H	H	OMe	CP,
Me	н	H	н	6	H	H	II.	OEt	CF3
Me	H	Me	Н	0	H	H	Н	OMe	CF,
Me	н	Me	Н	0	H	н	н	OEL	CF,
Me	Me	- 11	н	Ü	Me	H	H	OMe	CF ₃
Me	Me	н	н	0	Mc	Н	н	OEt	CF,
048	Me	H	H	٥	Εt	H	H	OMe	CP ₃

[0164]

【表123】

(132)

特開2002-308857

2	6	1

R¹	R ³	R*	R ⁴	n	\mathbb{R}^6	R	R4)	R*2	R**
Me	Mo	Ĥ	H	0	Εt	H	H	OEt	CF,
Me	Ne	Н	н	0	Pri	н	H	н	CF,
Me	Me	H	H	0	6x-1	H	H	OMe	CF ₂
Me	Me	H	Н	0	₽r~i	Ĭί	И	ΟEι	CF,
Me	Me	H	н	0	Me	Me	H	QMe	CF,
Me	Me	H	H	0	Me	Me	Н	O£t	CPs
Me	Et	Ħ	н	0	н	н	H	OMe	CF,
Me	Et	H	H	0	tt	11	t3	OEŧ	CF.
Ct	Ει	H	Н	Û	н	Ħ	H	ОМе	CF:
Eŧ	Æí	H	H	Ð	H	н	н	0Et	CF,
Me	Pr−i	н	н	0	н	н	н	OMe	CF ₃
Me	Pri	н	H	0	Н	H j	Н	0Et	CF,
Me	Pr	H	н	0	H	H	н	ОМе	CP _n
Me	Pr	H	Н	0	Ħ	H	н	OEL	CF.
Me	Pro	Я	Н	0	Н	EC	H	OMe	CF.
Me	Pric	H	H	0	н	н	H	OEt	CF3
Me	CH ₃ Prc	H	H	0	н	¥	H	OMe	CF ₃
Me	CH₂Pr-e	H	H	0	Н	н	н	OEt	CF;
-(0	H ₂) ₂ .	н	H	0	н	H	н	OMe	CF ₃
	$\langle H_2 \rangle_{i'}$	H	H	0	H	Н	H	0Et	CF ₂
	(H ₂) ₃ -	H	H	0	Н	Ħ	H	OMe	CF ₃
-(0	:H ₀ } ₃ -	Н	H	0	H	H	H	OEt	CF3
	H ₂),	H	Н	0	Н	н	H	ОМе	ÇF₃
	:H ₂).	H	н	0	Н	Ħ	Ð	OEt	CF ₃
-{ C	H ₂) ₅ .	H	Ħ	0	H	Ħ	H	OMe	CF.3
-{C	H2)5	H	H	0	Н	H	Н	OEt	CF _a
н	·(CH ₂)3·	н	ø	н	H	11	OMe	CF _a
Ħ	·(CH-		H	0	н	Ħ	f-l	0Et	CF ₃
H	H (CH,		H	0	H	Ħ	H	OMe	CF.,
H			H	0	H	H	н	OE't	CF ₀
Н	-(CH ₂		H	0	Ħ	H	H	OMe	CF,
H	-(CH₃		H	0	H	н	н	OEt	CF,
H	·(CH ²		H	0	Ħ	н	H	OMe	CF9
H	·(CH ₂) ₅ -	И	0	Н	н	H	OEt	CF,

【0165】 【数124】

(133)

特闘2002-308857

	R ¹ R ² R ³ R ⁴ R ⁶ R ⁶ R ⁶ R ⁵ R ⁵											
\mathbb{R}^{i}	R2	R ⁹	R4	n	\mathbb{R}^5	R ⁶	Ā1					
Me	Me	14	н	2	H	н	Pyridin-2-yl					
Me	Me	H	H	2	Н	H	Pyridin-2-yl 1-oxide					
Mo	Me	H	H	2	H	H	Pyridin-4-yl					
Me	Me		H	2	н	H	Pyridin-4-yl 1-oxide					
Me	Me .		H	2	H	H	1,2,4-Ozadiazol-3-yl					
Me	Me		H	2	H	K	8-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-6-yl					
Me	Me		H	2	H	H	8-Henzyl-1,2,4-oxadiazol-6-yl					
Me	Me		H	2	H	Ħ	2-Chlorothiazol-4-yl					
Mo	1		H	2	H	H	5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiasol-2-yl					
Me		Н	Ħ	2	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl					
Me	Me		H	2	H	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triasol-6-yl					
Me	Me Me	H	班	2 2	H	H	1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl 1-Difluoromethyl-1,2,4-triazol-5-yl					
Me	Me	н	II. H	2	H	H	4-Diffluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl					
Me	Me	Н	Н	2	H	Ħ	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Me	Me	11	H	2	н	H	4,6-Diethoxypyrimidio-2-y)					
Me			H	2	н	H	4.6-Dimethylpyrimidin-2-1					
Me			н	2	н	H	4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl					
Me	Me		H	8	н	н	4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl					
Me			н	2	Ħ	Ħ	4-Diffuoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl					
Me	Me	A	H	2	H	H	4-Phenoxy-6-methylpyrimidin-2-yl					
Me	Me	田	Н	2	н	н	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl					
Mo	Me	H	н	2	н	H	4-Methoxy-8-trifluoromethylpyrimidin-2-yl					
Me	Mo	H	H	2	И	H	4-Diffuoromethoxy-8-trifluoromethylpyrimidin-2-yl					
Me	Me	H	H	2	H	н	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl					
н	H	H	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyzimidin-2-yl					
Me		H	H	2	Н	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Me		Me		2	H	H	4,6-Dimethoxypyzimidin-2-yl					
Mo		H	H	2	Me	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Mo	Me	H	H	2	Et	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Me		H	Ħ	2	Pri	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Me Me		H	Ħ	2	Me		4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Et	Ex	田田	H	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
940		H	Н	2	н	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Me		H	H	2	H	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
Me		Н	FI	2	н	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
	CH2Pr-c	. –	н	2	н	H	4,8-Dimethoxypyrimidin-2-91					
	(CH),	H	Н	2	н	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
	-(CH ₂) ₃ -	Н	Н	2	н	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
	-(CH ₂) ₄ -	H	H	2	н	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl					
	·(CH ₂) _x ·	И	H	2	H	H	4,6-Dimothoxypyrimidin-2-yl					

[0166] 【数125】

(134)

特闘2002-308857

							(== :
		265					266
R	R ²	R ³	R'	n	Rh	Re	Y¹
1	-(CH ₀			H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl	
I	(CH,)4-	Н	2	H	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
I	(CH			2	H	H	4,8-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Įŧ			И	2	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
M	e Me	H	и	1	н	FI .	Pyridin-2-yl
М	e Me	н	H	1	н	H	Pyridin-2-yl 1-oxide
M	a Ma	н	14	1.	H	H	Pyridin-4-y)
M	e Me	H	H	1	H	H	Pyridin-4-yl 1-oxide
M	o Me	H	H	1	H	н	1,3,4-Oxediasol-3-yl
M	e Mie	H	B	1	H	Ħ	8-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl
M	e Me	H	H	Ł	H	H	3-Henzyl-1,2,4-oxadiaxol-5-yl
M	e Me	H	H	Ł	н	H	8-Chlorothiazol-4-yl
M	e Mo	H	H	1	H	H	5-Triflaoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl
М	e Me	H	H	L	н	H	1,4-Dimethylimidezol-5-yl
M	e Me	H	Ħ	1	Ħ	H	1-Phenyl-4-methoxycarbonyl-1,2,8-trizzol-5-yl
М	e Me	H	H	1	H	H	1-Diffuoremethyl-1,2,4-triazol-3-yl
M	c Me	H	Ħ	1	14	H	1-Diffluoromethyl-1,2,4-triasol-5-yl
М	e Me	H	н	1	H	H	4-Diffhtoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl
M		H	Ħ	1	H	H	4,8-Dimethoxypyrimidin-2-yl
M			n	1	H	H	4,6-Diethoxypyrimidin-9-yl
M	e Me	H	H	1.	н	H	4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl
M	e Me	H	11	1	Н	H	4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl
М	e Me	H	n	1	H	H	4-Methoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
M		Н	H	1	H	H	4-Difluoremethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl
M	_	H	H	1	H	H	4-Phenoxy-8-methylpyrimidin-2-yl
N		H	Ħ	1	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
N		Ħ	H	1	H	H	4-Methony-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl
M		H	H	1	H	H	4-Diffuoromethoxy-6-triffuoromethylpyrimidin-2-yl
M		H	H	1	H	Н	4-Phenoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-8-yl
]		H	H	1	H	Ħ	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
M	3		и	1	И	14	4,8-Dimethoxypyrimidin-2-yl
M		Me		1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
M		H	H ,	1	Me	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
M			H	1	Et	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yt
P		H	H	1	Pri	H	4.6-Dimethuxppyrimidin-2-yl
A		H	H	1	Me	Me	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
E		H	H	1 1	H	H	4,6-Dimethaxypyrimidin-2-yl
	le Pr-i	H	H	<u> </u>	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
	e Pr	H	H	1	н	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
	e Pr-c	H	H	1	;;	Ħ	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-91
	e CHoPro		Ħ	i	H	Ħ	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
٢	-(CH ₂) ₂ -	н	Н	i	Н	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
I	-(CH ₂) ₃ -	H	Ħ	1	Ħ	И	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
	-(CH2)4-	н	Н	1	н	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
L	-(CH ₂) ₅ -	H	Ħ	1	H	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
	(CH,)a-	H	1	H	н	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl

[0167]

【表126】

(135)

267

特闘2002-308857

268

R'	R ²	Ra	Rª	Д	P _p	R ⁶	$A_{\rm I}$		
H	-(CH ₈) ₄ -		H	1	H	Ħ	4,6-Dimethaxypyrimidin-2-yl		
B	-(CH ₂)		И	1	И	Я	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
R	-(CH ₂) ₆ -		н	1	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	Me	H	и	0	H	Я	Pyridin-2-yl		
Ma	Me	H	н	0	н	FI	Pyridin-2-yl 1-oxide		
Me	Me	H	H	8	н	Ħ	Pyridin-4-yl		
Me	Me	H	н	0	н	н	Pyridin-4-yl 1-oxide		
Me	Me	Ħ	B	0	H	н	1.2.4-Oxadiazol-8-vl		
Me	Me	н	н	0	н	Н	3-Phenyl-1,2,4-oxodiazal-5-yl		
Me	Me	H	8	0	H	н	3-Benzyl-1,2,4-oxodiozol-5-yl		
Me	Me	Ħ	Ħ	0	H	н	2-Chlorothiazol-4-yl		
Me	Me	н	H	0	H	Н	5-Trifluoromethyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl		
Me	Me	H	Ħ	0	н	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl		
Me	Me	Ħ	ਸ	0	H	H	1-Phanyl-4-methoxycarbonyl-1,2,3-triazol-5-yl		
Me	Mo	H	H	٥	н	Н	1-Diffluoremethyl-1,2,4-triasel-3-yl		
Me	Me	H	H	0	н	H	1-Diffluoromethyl-1,2,4-triasol-5-yl		
Mc	Mic	Ħ	н	0	н	Н	4-Diffluoromethyl-1,2,4-triazol-3-yl		
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	Me	Ħ	н	0	H	н	4,6-Diothoxypyrimidin-2-yl		
Me	Me	H	Ħ	0	н	त	4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl		
Me	Mo	H	H	0	H	н	4-Chloro-6-methylpyrimidin-2-yl		
Ma	Me	H	H	Ü	H	H	4-Methoxy-6-mothylpyrimidin-2-yl		
Me	Me	H	H	0	H	Ħ	4-Diffuoromethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl		
Me	Me	H	Н	Û	Н	Н	4-Phenoxy-8-methylpyrimidin-2-yl		
Me	Me	H	H	0	H	H	4-Chloro-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl		
Mo	Me	H	H	C	Ħ	Ħ	4-Methoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl		
Me	Me	PA	H	0	H	H	4-Diffuoromethoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl		
Me	Ma	H	H	0	H.	H	4-Phonoxy-6-trifluoromethylpyrimidin-2-yl		
H	H	1	Н	e	H	Ħ	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	H	H	H	a	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	H	Mc	_	0	H	Ħ	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	Me	H	H	0	Me	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Mo	Me	H	H	0	Et	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	Me	H	H	O	Pri	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Mo	Me	H	H	0	Me	Me	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Mo	E&	H	H	0	H	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Eŧ	Et	H	Н	0	H	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	Pri	Ħ	H	0	H	K	4.6 Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	Pr	H	H	0	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
Me	Pr-c CH ₂ Pr-c	H	ii H	0	H	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl 4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
	(Clip)		H	0	Н	H	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
	(CH ₂) _r	H	H	o	H	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
	(CH _e).	H	H	ă	н	Ħ	4.6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
	(CHP)2+	и	H	0	H	H	4,6-Dimethatypyrimidin-2-yl		
H	(CH ₂		H	ŏ	H	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl		
н	(CIL		н	ō	В	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-8-y)		

[0168]

【表127】

(136)

特闘2002-308857

270

\mathbb{R}^{1}	R ²	Rª	R4	Д	R ⁸	R ⁶	Ϋ́t
H	-(CH ₂)8-		H	0	Ħ	H	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
H	-(CH ₂)	6-	H	0	H	Н	4,6-Dimethoxypyrimidin-2-yl
Mo	Đt	Н	H	2	Ł	H	Pirrol-1-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	Oxazol-2-yl
Mo	Et	H	Ħ	2	H	Н	Thiazol-2-yl
Me	Et	Н	H	2	Н	H	Thianol-4-yl
Me	Et	Ħ	H	2	H	H	1,2,3.Thiadiazol-4-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	1,2,3-Thiadiazol-5-yl
Me	Bt	H	H	2	H	н	1,2,4-Thiadiazol-S-yl
Me	Bı	H	H	2	H	H	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
Me	Et	H	И	2	H	H	1,8,4-Thiadiazol-2-yl
Me	Et	Н	H	2	н	H	1,8,4-Thiadiazol-5-yl
Me	Bt	Н	H	2	H	Ħ	Pyridin-2-yl
Me	Bt	Н	H	2	H	Ħ	Pyridin-9-yt
Me	Et	H	Н	2	H	H	Pyridin-4-yl
Me	Et	H	H	2	Н	H	1H-Imidazol-2-yl
Me	Et	H	Ħ	2	Ħ	Ħ	1H-Imidazol-4-yl
Me	Et	H	H	2	Н	Н	lH-Imidazol-5-yl
Mo	Et.	H	H	2	H	н	1H-1,8,4-Triazol-2-yl
Me	Et	H	Ħ	2	H	Н	1H-1,8,4-Triazol-5-yl

[0169] [表128]

269

(137)

271

特闘2002-308857

272

	$ \begin{array}{c c} R^{1} & R^{2} & R^{3} \\ \hline Q & R^{4} & R^{6} \\ \hline Q & S(O) = Q - Y^{1} \end{array} $											
				Q ——	N	-8(0) <u>- (</u>	,2 ≻-Υ₁				
	R1	R ²	R ³	R ⁴	n	R ³	R ⁶	\mathbf{Y}^1				
ſ	Me	Me	H	Ι·Ι	2	H	H	Benzimidazol-2-yl				
Ì	Me	Me	Н	H	2	H	Н	Benzothiophen-2-yl				
I	Me	Me	H	Н	2	H	Н	3-Chlorobenzothiophen-2-yl				
ı	Me	Me	Н	H	2	H	H	Benzotriazol-1-yl				
l	Me	Me	H	H	2	H	H	1-Methylindazol-4-yl				
ı	Me	Me	H	H	2	Н	H	Benzothiazol-2-yl				
١	Me	Me	H	H	2	H		Benzothiophen-3-yl				
ı	Me	Me	H	H	2	H	H	5-Chlorobenzothiophen-3-yl				
ļ	Me	Mc	H	H	2	H		Benzoxazol-2-yl				
l	Me	Me	H	H	2	H	H	3-Methylbenzothiophen-2-yl				
1	Me	Me	H	H	2	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl				
1	Me	Me	H	H	2	H		Benzofuran-2-yl				
ı	Me	Me	H	H	2	H	H	2-Methylbenzofuran-7-yl				
ı	Me	Me	H	H	2	H	H	3-Bromobenzofuran-2-yl				
١	Me	Me	Н	H	2	H	H	Benzothiophen-7-yl				
1	Me	Me	H	H	2	H		1-Methylindazol-7-yl				
ı	Me	Me	H	H	2	H		1-Difluoromethylindazol-7-yl				
I	Me	Me	H	H	2	H		3-Methylbenzofuran-2-yl				
	Me	Me	H	H	2	H	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl				
I	Me	Me	Н	H	1	Н	H	Benzimidazol-2-yl				
ł	Me	Me	Н	H	1	H	H	Benzothiophen-2-yi				
ı	Me	Me	Н	H	1	Н		3-Chlorobenzothiophen-2-yl				
I	Me	Me	Н	H	1	H	H	Benzotriazol-1-yl				
1	Me	Me	H	H)	H	H	1-Methylindazol-4-yl				
ı	Me	Me	H	H	1	H		Benzothiazol-2-yl				
1	Me	Me	H	H	1	H		Benzotkiophen-3-yl				
1	Me	Me	H	H	1	H	H	5-Chlorobenzothiophen-3-yl				
1	Me	Me Me	H	H	1 1	H	H	Benzoxazol-2-yl 3-Methylbenzothiophen-2-yl				
1	Me Me	Me	Н	H	li	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl				
١	Me	Me	H	H	li	H	Н	Benzofuran-2-yl				
	Me	Me	Н	H	ľ	H		2-Methylbenzofuran-7-yl				
j	Me	Me	Н	H	i	н	H	3-Bromobenzofuran-2-yl				
1	Me	Me	H	Н	li	H	H	Benzothiophen-7-yl				
Ì	Me	Me	н	н	li	H	H	1-Methylindazol-7-yl				
١	Me	Me	н	H	li	H	н	3-Methylbenzofuran-2-yl				
١	Me	Me	Н	Н	١ĩ	Н	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl				
	Me	Me	Н	н	١٥	H	H	Benzimidazol-2-yl				
ĺ	Me	Me	Н	Н	0	Н	н	Benzothiophen-2-yl				
1	Me	Me	Н	H	ō	H	Н	3-Chlorobenzothiophen-2-yi				
1	Me	Me	H	H	0	Н	Н					
1	Me	Me	н	H	0	H	Н	1-Methylindazol-4-yl				

[0170]

【表129】

(138)

特闘2002-308857

		_				,-	1,04,0 0 0
	27	3	,				274
Ri	R ²	\mathbb{R}^3	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Υ ^t
Me	Me	H	H	0	Ħ		Benzothiazol-2-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	Benzothiophen-3-yl
Me	Me	H	Н	0	H		5-Chlorobenzothiophen-3-yl
Me	Me	H	H	0	H		Benzoxazol-2-yl
Me	Me	H	н	0	H		3-Methylbauzothiophen-2-yl
Me	Me	И	Н	0	H	H	3-Bromobenzothiophen-2-yl
Me	Me	ŀΙ	И	0	H		Benzofuran-2-yl
Me	Me	Н	Н	0	H		2-Methylbenzofuran-7-yl
Me	Me	H	Н	0	H		3-Bromobenzofuran-2-yl
Me	Me	H	H	0	Н	H	Benzothiophen-7-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	1-Methylindazol-7-yl
Me	Me	H	H	0	H	H	3-Methylbenzofurun-2-yl
Me	Me	H	H	0	Н	H	3-Chloro-1-methylindol-2-yl
Mo	Et	H	Н	2	H	H	Benzoxazol-2-yl
Me	Et	Н	H	2	Н	H	4-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	Н	H	2	H	H	5-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	14	H	2	H	H	6-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	Н	H	7-Chlorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	Н		4-Fluorobenzoxazol-2-yl
Me	Бt	H	H	2	H	H	5-Fluorobenzoxazol-2-yi
Me	Et	H	H	2	Н		6-Fluorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	Н	H	7-Fluorobenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	Н	2	H		4-Methylbenzoxezol-2-yl
Me	Et	H	H	2	Н		5-Methylbenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	6-Methylbenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	7-Methylbenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	Н	2	H	H	4-Methoxybenzoxazol-2-yl
Me	Et	Н	H	2 2	H	H	5-Methoxybenzoxazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	6-Methoxybenzoxazoi-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	Н	7-Methoxybenzoxazol-2-yl
Me Me	Et	H	H	2	H	H	Benzothiazol-2-yl
Me	Et Et	H	H	2	H	H	4-Chlorobenzothiazol-2-yl 5-Chlorobenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	出	2	Н	H	6-Chlorobenzothiazol-2-yl
Me	Et Et	Н	H	2	H	H	7-Chlorobenzothiazol-2-yl
Me	Br	H	H	2	H	H	4-Fluorobenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	Н	2	H	H	S-Fluorobenzothiazol-2-yl
1	Et	H	Н	2	Н	Н	6-Fluorobenzothiazol-2-yl
Me] El	11	П	<u></u> _	J 67	, 17	10-Limitoteranimam-r-Ai

[0171] 【表130】 (139)

特闘2002-308857

R¹	R²	R ³	R ⁴	n	R ⁵	R ⁶	Y ¹
Me	E	H	H	2	H	H	7-Pluorobenzothiazol-2-yi
Me	Et	н	H	2	H	H	4-Methylbenzothiazol-2-yl
Me	Ea	H	H	2	H	H	5-Methylbenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	Н	2	H	H	6-Methylbenzothiaznl-2-yl
Ме	Et	Н	H	2	Н	H	7-Methylbenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	Н	2	Н	H	4-Methoxybenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	5-Methoxybenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	Н	2	H	Н	6-Methoxybenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	7-Methoxybenzothiazol-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	Quinolin-2-yl
Me	Ει	H	H	2	H	H	Quinolin-6-yl
Me	Eı	H	H	2	Н	H	Quinoxalin-2-yl
Me	E	H	H	2	H		Benzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	Н	H	3-Chlorobenzofuran-2-yl
Me	E	H	Н	2	Н	H	4-Chlorobenzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	Н	H	5-Chlorobenzofuran-2-yl
Me	Et	Н	H	2	H	H	6-Chlorobenzoiuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	7-Chlorobenzoturan-2-yl
Me	Et	н	H	2	H	H	3-Methylbenzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	Н	H	4-Methylbenzofuran-2-yl
Me	Et	H	Н	2	H	H	5-Methylbenzofuran-2-yl
Me	Et	Н	H	2	H	H	6-Methylbenzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	7-Methylbenzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	3-Methoxybenzofuran-2-yl
Me	Εt	Н	H	2	Н	H	4-Methoxybenzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	H		5-Methoxybenzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	6-Methoxybenzofuran-2-yl
Me	Et	H	H	2	H	H	7-Methoxyoenzofuran-2-yl

```
【0172】一般式[1]を有する本発明化合物は、以
                              【0173】<製造法1> 工程1~工程5
下に示す製造法に従って製造することができるが、これ 30 【0174】
ちの方法に限定されるものではない。
                              [fb3]
```

【①176】(工程1)一般式 [5]で表されるスルフィド誘導体は、一般式 [1]で表される化台物と、一般式 [2]で示される水硫化ナトリウム水和物とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で(好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下反応させるととにより一般式 [3]で表されるメルカプタンの塩を反応系内で製造した後、メルカプタンの塩 [3]を単離することなく一般式 [4]で表されるハロゲン誘導体とを反応させること(場合によってはラジカル発生剤(例えばロンガリット(商品名): CH、(OH) SO、Na・2H、O等)を添加することができる)によって製造することができる。

【①177】反応温度はいずれの反応も0℃から反応系における遠流温度までの任意の温度で行い、好ましくは100℃~100℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが0、5時間~24時間で終了する。

【①178】反応に供される試剤の量は一般式[1]で 表される化台物1当置に対して、一般式[2]で表され る化合物又は一般式[4]で表される化台物は1~3当 置、塩基を使用する場合は、塩基①、5~3当量であ る。 【①179】溶媒としては、例えばジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N,Nージメチルアセトアミド、N,Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール又はtertーブタノール等のアルコール類、アセトン又は2ーブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

【①18①】塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロビルアミド等のアルカリ金属アミド類、ピリジン、トリエチルアミン又は1、8 ージアザビシクロ【5・4・0】- 7 ーウンデセン等の育機塩基類、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属直炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属直炭酸塩或いはナトリウムメトキシド又はカリウムtertーブトキシド等の金属アルコラートが挙げられる。

【①181】(工程2)一般式[6]で衰されるスルホキンド誘導体は、一般式[5]で衰されるスルフィド誘導体と酸化剤とを、適当な溶媒中で反応させるととにより製造することができる。

50 【0182】反応温度は0°Cから反応系における遠流温

特闘2002-308857

280

279

度までの任意の温度で行い。好ましくは()で~60℃の 温度範囲であり。反応は化合物により異なるが1時間~ 72時間で終了する。

【①183】反応に供される試剤の量は一般式[5]で 表される化台物1当置に対して酸化剤は1~3当量であ る。

【 0 1 8 4 】溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム、ジクロロエタン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)、ジメトキ 10シエタン又はジエチルエーテル等のエーテル類、N,Nージメチルアセトアミド、N,Nージメチルホルムアミド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロバノール、ブタノール又はtertーブタノール等のアルコール類、アセトン又は2ーブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリル類、酢酸、水或いはこれらの混合物が挙げられる。

【①185】酸化剤としては、例えば、m-クロロ過安 息香酸、過半酸又は過酢酸等の有機過酸化物、過酸化水 20 素、過マンガン酸カリウム又は過ヨウ素酸ナトリウム等 の無機過酸化物が挙げられる。

【①186】(工程3)一般式[7]で表されるスルホン誘導体は、一般式[6]で表されるスルホキンド誘導体と酸化剤とも、適当な溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【①187】反応温度は0℃から反応系における選流温度までの任意の温度で行い、好ましくは0℃~60℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが1時間~72時間で終了する。

[①188] 反応に供される試剤の量は一般式[6]で 表される化台物1当量に対して酸化剤は1~3当量であ 2

【0189】溶媒及び酸化剤としては、工程2と同様なものが挙げられる。

【0190】(工程4)一般式[7]で衰されるスルホン誘導体は、適当な溶媒中、一般式[5]で衰されるスルフィド誘導体と好適な酸化剤の置により一般式[6]で表されるスルホキシド誘導体を単態することなく製造することもできる。

【0191】反応温度は0℃から反応系における遺濾温度までの任意の温度で行い、好ましくは0℃~60℃の温度節囲であり、反応は化合物により異なるが1時間~72時間で終了する。

【0192】反応に供される試剤の量は一般式[5]で 表される化合物1当置に対して酸化剤は1~3当量であ る。

【0193】溶媒及び酸化剤としては、工程2と同様な

ものが挙げられる。

【①194】(工程5)一般式[5]で示されるスルフィド誘導体は、一般式[8]で表される化台物と、一般式[9]で示されるメルカブタン誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で(好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下で反応させることにより製造することができる。

【0195】反応温度は0℃から反応系における還流温度までの任意の温度で行い、好ましくは10℃~100℃の温度範囲であり、反応は化合物により異なるが0.5時間~24時間で終了する。

【①196】反応に供される試剤の量は一般式[8]で 表される化合物1当量に対して、一般式[9]で表され る化合物は1~3当量、塩基は0.5~3当量である。 【0197】溶媒としては、例えばジエチルエーテル、 ジメトキシエタン、ジオキサン又はテトラヒドロフラン {THF} 等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホ ルム、四塩化炭素、ジクロロエタン、クロロベンゼン又 はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化水素類、N.N ージメチルアセトアミド、N,N-ジメチルホルムアミ ド又はNーメチルー2ーピロリジノン等のアミド類、ジ メチルスルホキシド又はスルホラン等の硫貴化合物、ベ ンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭化水素類、 メタフール、エタノール、プロパノール、イソプロパノ ール、ブタノール又はtertーブタノール等のアルコール 類、アセトン又は2-ブタノン等のケトン類、アセトニ トリル等のニトリル類、水或いはこれらの混合物が挙げ ちれる。

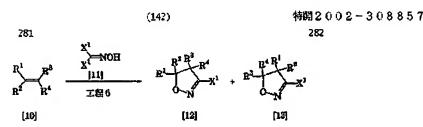
【0198】塩基としては、例えば水素化ナトリウム等の金属水素化物、ナトリウムアミド又はリチウムジイソプロビルアミド等のアルカリ金属アミド、ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウム等のアルカリ金属直炭酸塩或いはナトリウムメトキシド又はカリウムでナーブトキシド等の金属アルコラー40トが挙げられる。

【①199】一般式 [8]で示される化合物のうちしが ハロゲン原子で表される化合物 [12]は工程6で示さ れる方法により製造することができ、必要に応じ [1 2]と [13]を分離精製して化合物 [12]を得る。

【0200】(工程6)

[0201]

[化4]



【0202】(式中、X1、R1, R1, R1及びR1は前 記と同じ意味を表す。 > 一般式 [12]及び [13]で 裹されるイソオキサゾリン化合物は、一般式[10]で るオキシム誘導体とを、溶媒中又は溶媒の非存在下で (好ましくは適当な溶媒中)、塩基の存在下で反応させ ることにより製造することができる。但し、R1, R1の 両者が水素原子の場合には一般式 [12]で表されるイ ソオキサゾリン化合物が優先的に得られる。

【0203】反応温度は0°Cから反応系における遠流温 度までの任意の温度で行い、好ましくは10℃~80℃ の温度範囲であり、反応は化合物により異なるがり、5 時間~2週間で終了する。

【0204】反応に供される試剤の量は一般式〔11〕 で表される化合物1当量に対して、一般式[10]で表 される化合物は1~3当堂である。

【0205】溶媒としては、例えばエチレングリコール ジメチルエーテル、エチレングリコールジェチルエーテ ル、ジエチルエーテル、ジオキサン又はテトラヒドロフ ラン等のエーテル類、ジクロロエタン、四塩化炭素、ク ロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハロゲン化炭化 水素類、ベンゼン、トルエン又はキシレン等の芳香族炭 化水素類、酢酸エチル又は酢酸ブチル等の酢酸エステル 類、水或いはこれらの混合物等が挙げられる。

*【0206】塩薑としては、例えば水酸化ナトリウム又 は水酸化カリウム等のアルカリ金層水酸化物、水酸化カ ルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類金属 表されるオレフィン誘導体と、一般式[11]で示され 10 水酸化物、炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のアルカ リ金属炭酸塩、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素カリウ ム等のアルカリ金属重炭酸塩、酢酸ナトリウム又は酢酸 カリウム等のアルカリ金属酢酸塩、フッ化ナトリウム又 はフッ化カリウム等のアルカリ金属のフッ素化塩或いは ピリジン、トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシク ロ[5.4.0]-7-ウンデセン等の有機塩基等が挙げ **ちれる。**

> 【0207】尚、上記製造方法で用いる製造中間体であ る一般式[10]で表される化合物は、市販のものを用 20 いるか、又はウィッティヒ (Wittig) 反応等の公知の反 応により製造することができる。また、一般式[11] で示される化合物は、例えば、Liebigs Annalen der Ch enie. 985 (1989) に記載の方法に進じて製造すること ができる。

【0208】一般式[1]で衰される化合物は、前記に 示した一般式[12]で表される化合物から以下の方法 により製造することができる。

[0209] [1k5]

【0210】(式中、X1、R1、R1、R1、R1及びR1 は前記と同じ意味を表す。)

一般式[15]で表される化合物は前記記載の工程5、

一般式[16]で表される化合物は前記記載の工程2、

一般式[1]で表される化合物は化合物[15]から前 記記載の工程4又は化合物[16]から工程3で示した 方法に進じ製造することができる。

【0211】溶媒、塩基及び酸化剤としては工程2、エ 50

程3、工程4又は工程5で記載したものと同じものが挙 げられる。

【0212】一般式〔4〕で表される化合物中、一般式 [21]で表される化合物は、以下の方法により製造す ることができる.

[0243]

[化6]

(143)

特開2002-308857

284

283 1171 型元初 HO-CHR5-Y X1-CHR6-Y [18] 1201 工程!! 工程は [19]

【0214】(式中、R'、X'及びYは前記と同じ意味 を表し、R'はアルキル基を表す。)

(工程11)一般式[20]で表される化合物は、化合 物[17]、[18]又は[19]と還元剤とを溶媒中 で反応することにより製造することができる。

【0215】との反応は通常、反応温度-60~150 ℃で10分~24時間反応させる。

【①216】反応に供される試剤の壁は、化合物〔1 7]. [18] 又は[19] 1当置に対して、返元剤 0. 5~2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意 に変化させることができる。

【0217】 遠元剤としては、 [17] から [20] の 20 製造では、例えば水素化ジイソブチルアルミニウム等の 金属水素化物。或いは水素化ホウ素ナトリウム又は水素 (化リチウムアルミニウム等の金属水素館化合物が、[1 8] 又は[19] から[20] の製造では、例えば水素 化ジイソブチルアルミニウム等の金属水素化物。水素化 ホウ素ナトリウム又は水素化リチウムアルミニウム等の 金属水素錯化合物、或いはジボランが挙げられる。

【0218】溶媒としては、例えばジエチルエーテル、 テトラヒドロフラン又はジオキサン等のエーテル類、ベ ンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類、メタノール 30 ロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド。 又はエタノール等のアルコール類が挙げられる。

【0219】(工程12)一般式[21]で表される化 合物は、化合物〔20〕とハロゲン化剤とを溶媒中で反 応させることにより製造することができる。

【0220】との反応は通常、反応温度-50~100 ℃で10分~24時間反応させる。

【0221】反応に供される試剤の量は化合物〔20〕 1当量に対して、ハロゲン化剤1~3当量が蛭ましい が、反応の状況に応じて任意に変化させることができ

【0222】ハロゲン化剤としては、例えば塩化水素、 臭化水素、三塩化リン、三臭化リン又は塩化チオニル等 が挙げられる。

【0223】溶媒としては、例えばジクロロエタン又は 四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸等の酸類或 いはテトラヒドロフラン等のエーテル類が挙げられる。

【0224】一般式[4]で衰される化合物は、以下の 方法により製造することができる。

[0225]

【化7】

【0226】(式中、R'、R'、X'及びYは前記と同 じ意味を表す。)

一般式[4]で表される化合物は、化合物[22]とハ ロゲン化剤とを溶媒中、触媒の存在下又は非存在下で反 応させることにより製造することができる。

【0227】との反応は通常、反応温度30~150℃ で10分~24時間反応させる。

【()228】反応に供される試剤の量は化合物[22] 1当堂に対して、ハロゲン化剤1~10当量が望ましい が、反応の状況に応じて任意に変化させることができ る。触媒は0.01~0.5当量である。

【0229】ハロゲン化剤としては、例えば臭素又は塩 素等のハロゲン、Nープロモコハク酸イミド等のNーハ ロコハク酸イミド、或いは過臭化ピリジニウム等のピリ ジン塩等が挙げられる。

【0230】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四 塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハ N,N-ジメチルホルムアミド又はN-メチルー2ービ ロリジノン等のアミド類。ジメチルスルホキシド又はス ルホラン等の確粛化合物、丰酸、又は酢酸等のカルボン 酸類が挙げられる。

【0231】触媒としては、例えば過酸化ベンゾイル、 α , α -アゾビスイソブチロニトリル又はこれらの混合 物が挙げられる。

【0232】一般式[4]で表される化合物中、一般式 [24]で表される化台物は、以下の方法により製造す 40 るととができる。

[0233]

[(t8]

【0234】(式中、X1及びYは前配と同じ意味を表

一般式 [2 4] で衰される化台物は、(Org.Synth.,II I,557(1955)) 又は(J.Am.Chem.Soc.,72,2216(1950)) 50 に記載の方法に導じて、化合物 [23] とハロゲン化水

特闘2002-308857

素とホルムアルデヒド又はパラホルムアルデヒドとを終 媒中、ルイス酸存在下もしくは非存在下で反応させる か. 或いは (J.An.Chen.Soc., 97,6155(1975)) に記載の 方法に進じて、化合物 [23] とハロゲノメチルエーテ ルとを密媒中、ルイス酸存在下、反応させる方法により 製造することができる。

285

【0235】との反応は通常、反応温度-40~150 ℃で10分~24時間反応させる。

【0236】反応に供される試剤の量は化合物〔23〕 1 当量に対して、ハロゲン化水素、ホルムアルデヒド、 パラホルムアルデヒド、ルイス酸又はハロゲノメチルエ ーテル1~2当量が望ましいが、反応の状況に応じて任 意に変化させることができる。

【0237】ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、 塩化亜鉛、塩化アルミニウム又は臭化亜鉛等が挙げられ る。

【0238】ハロゲン化水素としては、塩化水素、臭化 水素又はヨウ化水素が挙げられる。

【0239】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四 塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、 ヘキサン又はヘブタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキザ ン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、酢酸等のカ ルボン酸類、二歳化炭素或いはそれらの混合物が挙げら ns.

【0240】一般式[19]で表される化合物中、一般 式[25]で表される化合物は、以下の方法により製造 することができる。

[0241]

[(19]

HÇ∙Y Y-14 [(£10] 工档15 [28][25] * [17] Mentag Y2MeY \mathbf{z} 求能子 試藏 Li 試藝 27 [18] X2-Y XX RSC-Y 工程16 工程17 1191 Li-Y [26]

[28]

【0249】(式中、R1,R1及びYは前記と同じ意味 を表し、X1は塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を表 す。)

一般式[17]、[18]、[19]又は[20]で表 される化合物は、(J.Org. Chem., 65, 4618(7000))に記 載方法に準じて、化合物 [26] とマグネシウム試薬と を治媒中又は治媒の非存在下、反応させて化合物〔2 7] を得た後、求電子試薬と反応させるか、或いは(Synt h. Commun., 24(2)、253(1994))に記載方法に進じて. 化合物 [26] とnープチルリチウムとを溶媒中で反応 させて化合物 [28]を得た後、求電子試薬と反応させ 50

*【0242】(式中、Yは前記と同じ意味を表す。)

一般式 [2 5] で衰される化合物は、(Org.Synth.,IV, 831(1963)) に記載のビルスマイヤー (Vilsmeier) 法に 進じて、化合物[23]とN,N-ジメチルホルムアミ ドとを塩化ホスポリル、ホスゲン又は塩化チオニル存在 下、溶媒中又は溶媒の非存在下で反応させるか、或いは 《Chem.Ber.,93,88(1960)》に記載の方法に導じて、化 台物[23]とジハロゲノメチルエーテルとを溶媒中、 ルイス酸存在下、反応させた後、加水分解させる方法に 10 より製造することができる。

【0243】この反応は通常、反応温度-40~150 ℃で10分~24時間反応させる。

【0244】反応に供される試剤の量は化合物 [23] 1 当量に対して、塩化ホスホリル、ホスゲン、塩化チオ ニル、N,N-ジメチルホルムアミド、ルイス酸又はジ ハロゲノメチルエーテル1~2当置が望ましいが、反応 の状況に応じて任意に変化させることができる。

【0245】ルイス酸としては、例えば四塩化チタン、 四塩化スズ、塩化亜鉛、塩化アルミニウム又は臭化亜鉛 20 等が挙げられる。

【0246】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四 塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、 ヘキサン又はヘブタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキサ ン又はテトラヒドロフラン等のエーテル領、酢酸等のカ ルボン酸類、N、N-ジメチルホルムアミド等のアミド 類。二硫化炭素或いはそれらの混合物が挙げられる。 [0247] 一般式[17]、[18]、[19]及び [20]で衰される化合物は、以下の方法により製造す るととができる。

30 [0248]

る方法により製造することができる。

HOCH-Y [20]

【0250】との反応は通常、反応温度-100~15 0°Cで10分~24時間反応させる。

【0251】反応に供される試剤の量は化合物【26】 1 当量に対して、マグネシウム試薬又はリチウム試薬1 ~5 当置、求電子試業1~5 当置が望ましいが、反応の 状況に応じて任意に変化させることができる。

【①252】マグネシウム試薬としては、例えば金属マ グネシウム、臭化イソプロビルマグネシウム又はジイソ プロビルマグネシウム等が挙げられる。

【0253】リチウム試薬としては、例えばnープチル

2/16/2005

(145)

10

特闘2002-308857

288

287

リチウム、secープチルリチウム又はtertープチルリチ ウム等が挙げられる。

【0254】求電子試薬としては、例えばギ酸エチル、 シアノギ酸エチル又は酢酸エチル等のエステル類。アセ チルクロリド又はクロロギ酸メチル等の酸ハライド類、 N、N-ジメチルホルムアミド等のアミド類。パラホル ムアルデヒド等のアルデヒド類、或いは二酸化炭素が挙 けられる。

【0255】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四 塩化炭素又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類、 ヘキサン又はペンタン等の脂肪族炭化水素類、ジオキザ ン又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、或いはそれ らの混合物が挙げられる。

【0256】一般式[31]で表される化合物は、以下 の方法により製造することができる。

[0257]

[(11]

【() 2.5.8 】 (式中、Yは前記と同じ意味を表し、R* はアルキル基。ハロアルキル基、シクロアルキル基、シ クロアルキルアルキル基。アルコキシカルボニルアルキ ル基、置換されていてもよいベンジル基、置換されてい でもよいヘテロ環アルキル基、アルケニル基、アルキニ ル基、アルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル 基、置換されていてもよい芳香族へテロ環基、置換され ていてもよいフェニルスルホニル基。アシル基。ハロア ルキルカルボニル基、置換されていてもよいベンジルカ ルボニル基又は置換されていてもよいベンゾイル基を表 し、L¹はハロゲン原子、C1~C4アルキルスルホナー ト基、C1~C4アルキルスルホニル基、置換されていて もよいベンジルスルホニル基、置換されていてもよいフ ェニルスルホナート基又は置換されていてもよいベンジ ルスルホナート芸等の脱離基を表す。但し、R*がハロ アルキル基の場合は、Liはハロアルキル化して残った ハロゲン原子より反応性の高い脱離基を表す。例えばC F,基の場合は塩素原子、臭素原子、pートルエンスル ホニルオキシ甚又はメチルスルホニルオキシ基等を表

一般式 [31]で表される化合物は、化合物 [29] と 化合物 [30] とを恣媒中、塩基存在下で反応させるこ とにより製造することができる。

【0259】この反応は通常、反応温度0~120℃で 10分~24時間反応させる。

【0260】反応に供される試剤の量は化合物[29]

1~3当費である。

【0261】塩基としては、例えば炭酸ナトリウム又は 炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸塩、水酸化ナトリウ ム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水素 化カリウム又は水素化ナトリウム等アルカリ金属水素化 物。ナトリウムエトキシド又はナトリウムメトキシド等 のアルカリ金属アルコラート、或いは1,8-ジアザビ シクロ [5,4,0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基が挙 けられる。

【0262】溶媒としては例えばジクロロメタン又はク ロロホルム等のハロゲン化炭化水素類。ジエチルエーテ ル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又 はトルエン等の芳香族炭化水素類、ヘキサン又はヘブタ ン等の脂肪族炭化水素類。アセトン又はメチルイソブチ ルケトン等のケトン類、酢酸エチル又は酢酸メチル等の エステル類、N-メチルピロリドン又はN, N-ジメチ ルホルムアミド等のアミド類、ジメチルスルホキシド又 はスルホラン等の硫黄化合物、アセトニトリル等のニト リル類、或いはそれらの混合物が挙げられる。

20 【0263】一般式 [34]で表される化合物は、以下 の方法により製造することができる。

[0264]

[(12]

【() 2.6.5】 (式中、L1は前記と同じ意味を表し、R 1°はアルキル芸。前記と同じ意味の置換基群&より選択 される任意の基でモノ置換されたアルキル基、ハロアル キル基、シクロアルキル基、アルケニル基、アルキニル 基。アルキルスルフィニル基、アルキルスルホニル基、 前記と同じ意味の置換基群でより選択される任意の基で モノ置換されたアルキルスルホニル基。ハロアルキルス ルホニル基、置換されていてもよいフェニル基、置換さ れていてもよい芳香族へテロ環基、置換されていてもよ いフェニルスルホニル基、置換されていてもよい芳香族 ヘテロスルホニル基、アシル基、ハロアルキルカルボニ ル幕、置換されていてもよいベンジルカルボニル幕、置 HF2基の場合は塩素原子又は臭素原子を表し、CH2C 40 換されていてもよいベンゾイル基、アルコキシカルボニ ル基、置換されていてもよいベンジルオキシカルボニル 基、置換されていてもよいフェノキシカルボニル基、カ ルバモイル基(該基の窒素原子は同一又は異なって、ア ルキル基又は置換されていてもよいフェニル基で置換さ れていてもよい)を哀す。この場合、ビラゾール頃の炭 素原子は、前記と同じ意味の置換基群 a より選択され る。1~2個の同一又は祖異なる基で置換されていても £41.)

一般式[34]で表される化合物は、化合物[32]と 1 当量に対して化合物 [30] は1~20当費。塩基は 50 化合物 [33]とを溶媒中、塩基存在下で反応させるこ

特闘2002-308857

290

とにより製造することができる。

【0266】との反応は通常、反応温度0~120℃で10分~24時間反応させる。反応に供される試剤の登は化合物[32]1当置に対して化合物[33]は1~20当置、塩基は1~3当量である。

289

【0267】塩基及び溶媒としては、例えば一般式 [29]から一般式 [31]の製造と同様なものが挙げられる。

【0268】Yにトリフルオロメチル墓を導入する方法 として、J.Chem. Soc. Perkin Trans.1,8, 2293-2299 (1990), J.Fluorine Chem., 50(3), 411-426 (1990). J.Chem. Soc. Chem. Commun., 18, 1389-1391 (1993). J. Chem. Soc. Chem. Commun., 1, 53-54 (1992), Chem. .Lett., 1719-1720 (1981), Chem. Pharm. Bull., 38 (9), 2446-2458 (1990), J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 921-926 (1988). Heterocycles, 37(2),775-782 (1 994). Tetrahedron Lett., 30(16), 2133-2136 (198 9). J. Chem. Soc. Perkin Trans.1, 2755-2761 (198 0). Heterocycles, 22(1),117-124 (1984), Eur. J. Me d. Chem. Chim. Ther., 24, 249-258 (1989), Acta Ch 20 en. Scand. Ser. 8, 38(6),505-508 (1984). J. Fluori ne Chem., 21,495-514 (1982), J. Chem. Soc. Chem. Co. mmun., 10, 638-639 (1988), J. FluorineChem.,67(1), 5-6 (1994), J. Heterocycl. Chem., 31(6), 1413-1416 (1994). Chem. Heterocycl. Compd., 30(5), 576-578 (1994). J. Fluorine Chem., 78(2),177-182 (1996). J. Heterocycl. Chem., 34(2), 551-556 (1997), Tetra hedron, 55(52),15067-15070 (1999), Synthesis, 11,9 32-933 (1980)に記載の方法又は準じた方法等が挙げら れる

また、一般式[4]、[17]、[18]、[19]、 [20], [21], [22], [23], [24], [25]、[26]、[29]及び[31]は、Yがフ リル基の場合は(Methoden der Organischen Chemne,E6 a,16-185 (1994))、Yがチエニル基の場合は(Method en der Organischen Chemie,E6a ,186 - 555(1994)). Yがピロリル華の場合は(Methoden der Organischen C hemie,E6a,556-798(1994)) Yがピラゾリル基の場 台は(Methoden der Organischen Chemne,E8b),399-76 3(1994))、特別平2000-219679号公報明細書、Yがイ ソキサゾリル基の場合は(Methoden der Graanischen C hemne,E8a,45-225(1993)〉、Yがイソチアゾリル基の 場合は(Methoden der Organischen Chemie,E8a,568-7 98(1993))、Yがオキサゾリル基の場合は (Methoden d er Organischen Chemie, E8a, 891 - 1019 1993), Y# チアゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Che me,E8b ,1-398(1994))、Yがイミダゾリル基の場合 lt (Methoden der Organischen Chemie,E8c ,1-215(19 94))、Yがピリジル基の場合は(Methodender Organis

chen Chemie,E7a,286-686 (1992)). Yがピリダジニ ル基の場合は(Methoden der Organischen Cheme.E9a、 557-682(1997))、Yがビリミジニル基の場合は(Meth oden der Groanischen Chemie, E9b /1, 1 = 249(199)8)) . Yがビラジニル基の場合は (Methoden der Organ ischen Chemie,E9b / 1,250-372(1998)) 、Yがトリア ジニル基の場合は(Mexhoden der Organischen Chemie、 E9c,530-796(<u>1</u>998))、Yがトリアゾリル基の場合は (Methoden der Organischen Chemie, E8d, 305 - 405, 47 10 9-598 (1994))、Yがオキサジアゾリル基の場合は (Methoden der Organischen Cheme, E&c., 397-818(199 4)) Yがチアジアゾリル基の場合は(Methoden der O rganischen Chemie,E8d,59-304(1994)). Yがベンゾ フリル基の場合は(Methoden der Organischen Chamie, E6b1、33-216(1994))、国際特許出類公開公報WO-1997 /29105号明細書、Yがベンゾチエニル基の場合は(Meth oden der Organischen Chemne E6b1,217-322 (199 4))、Yがインドリル基の場合は(Methoden der Organ ischen Chewie, E6b1, 546-848 (1994)), (Methoden der Organischen Chemie, E6b2, 849-1336 (1994)). 国際特許出類公開公報WD-1997/42188-A1号明細書、Yが ベンゾオキサゾリル基の場合は(Methoden der Organis chen Chemie,E8a,1020-1194 (1993))、Yがベンゾチ アゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemi e. E8b.865-1052 (1994)〉、Yがベンゾイミダゾリル 基の場合は(Methoden der Organischen Chemie,E8c,21 6- 391(1994))、Yがベンゾイソキサゾリル基の場合は (Methoden der Organischen Chemie, E8a, 226-348 (1993))、Yがベンゾイソチアゾリル基の場合は (Meth 30 oden der Organischen Chemie, E8a, 799 - 852 (199 3)) 、Yがインダゾリル蟇の場合は(Methoden der Orq anischen Chemie,E8b,764-864(1994))、 Yがキノリル 基の場合は(Methoden der Organischen Chemie,E7a,29 G-570(1991)) Yがイソキノリル基の場合は (Method en der Organischen Chemne,E7a,571-758(1991)), Y がフサラジニル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie、E9a,744-789(1997))、 Yがキノキザリニル基 の場合は (Methoden der Organischen Chemie,E9b/2,93 -265 (1998)) . Yがキナゾリニル苗の場合は (Method en der Organischen Chemie, E9b/2,1-192 (1998)), Yがシンノリニル基の場合は(Methoden der Organisch en Chamie,E9a,683-743(1997)) 又はYがベンゾトリア ゾリル基の場合は(Methoden der Organischen Chemie、 E8d,406-478(1994)) 記載の方法又は準じた方法等で製 造することができる。

[0269]<製造法2> [0270]

[ft13]

(147)

特闘2002-308857

292

【0271】(式中、R1、R1、R1、R1、R1、R1及びR1 は前記と同じ意味を表す。この場合、ピラゾール環の炭 素原子は、前記と同じ意味の置換基群αより選択され £41.)

一般式[36]で表される本発明化合物は、製造法1に より製造することができる本発明化合物【35】と酸と を溶媒中で反応させることにより製造することができ る.

【0272】との反応は通常、反応温度0~120℃で 10分~24時間反応させる。

【0273】反応に供される試剤の量は化合物〔35〕 1当量に対して、酸1~10当量が望ましいが、反応の*

[87]

【0278】(式中、n. Li, Ri, Ri, Ri, Ri, R'、R'及びR'では前記と同じ意味を表す。この場合、 ビラゾール環の炭素原子は、前記と同じ意味の置換基群

換されていてもよい。) 一般式[37]で表される本発明化合物は、本発明化合 物[36]と一般式[33]で表される化合物とを溶媒 中、塩基存在下、反応させることにより製造することが できる。

αより選択される、1~2個の同一又は相異なる基で置

【0279】反応に供される試剤の量は一般式〔36〕 で表される化合物1当費に対して、一般式[33]で表 される化合物は1~3当量であり、塩基は、1~3当量 である。

【0280】溶媒としては、例えばジオキサン又はテト タン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼ ン等のハロゲン化炭化水素類、N.Nージメチルアセト アミド、N,Nージメチルホルムアミド又はNーメチル -2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシ ド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン *状況に応じて任意に変化させることができる。

【0274】酸としては、例えば塩酸、臭化水素酸、ト リフルオロ酢酸等が挙げられる。

る。1~2個の同一又は祖異なる基で面換されていても 10 【0275】溶媒としては、例えばジクロロエタン、四 塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等のハ ロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセトアミド、 N.Nージメチルホルムアミド又はN-メチルー2-ビ ロリジノン等のアミド類。ジメチルスルホキシド又はス ルホラン等の確實化合物。主酸又は酢酸等のカルボン酸 類或いは水が挙げられる。

> 【0276】<製造法3> [0277]

[(14]

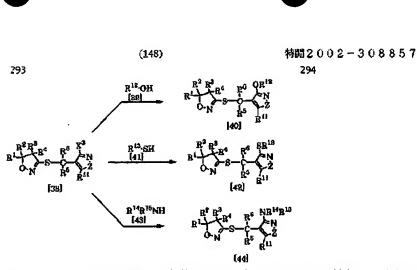
又はキシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタ ノール、プロバノール、イソプロパノール、ブタノール 又はtert-ブタノール等のアルコール類、アセトン又は 2-ブタノン等のケトン類、アセトニトリル等のニトリ 30 ル類、水政いはこれらの混合物が挙げられる。

【0281】塩基としては、例えば水素化ナトリウム等 の金属水素化物。ナトリウムアミド又はリチウムジイソ プロビルアミド等のアルカリ金属アミド類、ピリジン、 トリエチルアミン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4. ()] -7-ウンデセン等の有機塩基類、水酸化ナトリウ ム又は水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、水酸 化カルシウム又は水酸化マグネシウム等のアルカリ土類 金属水酸化物。炭酸ナトリウム又は炭酸カリウム等のア ルカリ金属炭酸塩類、炭酸水素ナトリウム又は炭酸水素 ラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、ジクロロエ 40 カリウム等のアルカリ金属重炭酸塩、酸いはナトリウム メトキシド又はカリウムtert-ブトキシド等の金属アル コラート等が挙げられる。

【0282】<製造法4>

[0283]

[ft15]



【0284】(式中、R1、R1、R1、R1、R1及びR1 は前記と同じ意味を表し、R**はトリフルオロメチル 基。ジフルオロメチル基又はジフルオロメトキシ基を表 し、X'は塩素原子又はフッ素原子を表し、R''はアル キル基、ハロアルキル基。シクロアルキル基、シクロア ルキルアルキル墓、アルケニル基、アルキニル墓、置換 されていてもよいフェニル基、置換されていてもよい芳 換されていてもよいヘテロ環アルキル基、又は置換され ていてもよいベンジル基を表し、R**はアルキル基、ハ ロアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、置換 されていてもよい芳香族へテロ環基。アルコキシカルボ ニルアルキル基又は置換されていてもよいベンジル基を 表し、R**及びR**は同一又は異なって、水素原子、ア ルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル 基。ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよい ベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイ 基、置換されていてもよいベンジルスルホニル基又は置 換されていてもよいフェニルスルホニル基を表し、2は 酸素原子、イオウ原子又はN-R¹⁰を表し、R¹⁰は水素 原子又は前記と同じ意味のR**を表す。)

一般式 [40]. 一般式 [42] 又は一般式 [44] で 表される本発明化合物は、一般式 [38] で表される本 発明化合物とそれぞれ化合物 [39]. 化合物 [41] 又は化合物 [43] とを無溶媒又は溶媒中、必要に応じ* * 塩基存在下、反応させることにより製造することができる。

【0285】との反応は通常、反応温度20~200℃、好ましくは30~180℃で10分~48時間、必要に応じ加圧下で反応させる。

ルキルアルキル甚、アルケニル基、アルキニル甚、置換されていてもよい芳 を振へテロ環甚、アルコキシカルボニルアルキル甚、置換されていてもよい今テロ環アルキル基、又は置換されていてもよいへテロ環アルキル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表し、R**はアルキル基、 置換されていてもよいブェニル芸、置換されていてもよいブェニル芸、置換されていてもよい芳香族へテロ環基、アルコキシカルボニルアルキル甚又は置換されていてもよいブェニル芸、置換されていてもよいブェニル芸、置換されていてもよいブェニル芸、置換されていてもよいベンジル基を を展アルコラート、1、8 - ジアザビシクロ [5・4・表し、R**及びR**は同一又は異なって、水素原子、ア 0] - 7 - ウンデセン等の有機塩基が挙げられる・

ルキル基、置換されていてもよいフェニル基、アシル
基、ハロアルキルカルボニル基、置換されていてもよい
ベンジルカルボニル基、置換されていてもよいベンゾイ
ル基、アルキルスルホニル基、ハロアルキルスルホニル
30
族炭化水素類、ジェチルエーテル又はテトラヒドロ
フラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香
族炭化水素類。ヘキサン又はヘブタン等の脂肪族炭化水
素類。アセトン又はメチルイソブチルケトン等のケトン
換されていてもよいフェニルスルホニル基を表し。
2
放素原子、イオウ原子又はN-R1°を表し、R1°は水素
原子又は前記と同じ意味のR1°を表す。
一般式 [40]、一般式 [42] 又は一般式 [44] で
トニトリル或いはそれらの混合物が挙げられる。

【0288】<製造法5> 【0289】

[1616]

一般式 [46]で表される本発明化合物は、本発明化合物 [45]と酸とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0291】この反応は通常、反応温度0~120℃で 50 のが挙げられる。

109~24時間反応させる。反応に供される試剤の登は化合物 [45] 1当置に対して、敗1~<math>10当置が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。

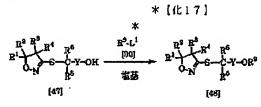
【0292】酸及び溶媒としては、製造法2と同様なものが挙げられる。

(149)

特闘2002-308857

295

<製造法6> [0293]



【0294】(式中、Y. R¹, R¹, R¹, R¹, R¹, R¹, R'、R'及びL'は前記と同じ意味を表す。この場合。 Yは前記と同じ意味の置換基群αより選択される。1~ 5 個までの同一又は相異なる基で置換されていてもよ (...)

一般式[48]で表される本発明化合物は、本発明化合 物[47]と化合物[30]とを溶媒中、塩基存在下、 反応させることにより製造することができる。

【0295】との反応は通常、反応温度0~150℃で※

【0299】(式中、Y. R', R', R', R', R'及 びR*は前記と同じ意味を表し、R**はアルキル基、置 換されていてもよいベンジル基又は置換されていてもよ いフェニル基を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の 置換基群でより選択される。1~5個までの同一又は相 異なる基で置換されていてもよい。)

一般式 [50] で表される本発明化合物は、本発明化合 物[49]を水又は水と混合した溶媒中、塩基存在下又

【0300】との反応は通常、反応温度0~100℃で 10分~24時間反応させる。

【①301】反応に供される試剤の量は化合物〔49〕 1当量に対して、塩基を使用する場合1~2当量が望ま しいが、反応の状況に応じて任意に変化させるととがで★

★きる。

ができる。

ものが挙げられる。

[0298]

【0297】<製造法7>

【0302】塩基としては、例えば炭酸カリウム、水素 化ナトリウム又は水酸化ナトリウム等の無機塩基、1, 8-ジアザビシクロ [5.4.0] -7-ウンデセン等の 有機塩基が挙げられる。

※10分~24時間反応させる。反応に供される試剤の置

は化合物[47]1当置に対して、酸1~1.2当置が

【0296】塩基及び溶媒としては、製造法3と同様な

10 望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させること

【0303】水と混合する溶媒としては、例えばメタノ ール又はエタノール等のアルコール類。テトラヒドロフ ラン等のエーテル領、アセトン又はメチルイソブチルケ は非存在下、鮑水分解させることにより製造することが 30 トン等のケトン類、N ,N-ジメチルホルムアミド等の アミド領、ジメチルスルホキシド又はスルホラン等の硫 黄化合物、アセトニトリル或いはそれらの混合物が挙げ られる。

【0304】<製造法8>

[0305]

[(19)

[0306] (式中、Y. Ri. Ri. Ri. Ri. Ri. R®及びR®は前記と同じ意味を表し、R™はアルキル基 を表す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群αよ り選択される。1~5個までの同一又は相異なる基で置 換されていてもよい。〉

一般式[53]で表される本発明化合物は、本発明化合 物[51]と化合物[52]とを密媒中、塩基存在下、 反応させることにより製造することができる。この反応 は通常、反応温度①~100℃で10分~24時間反応 50 チルアミン又は1,8-ジアザビシクロ【5.4.0】-

させる。

【0307】反応に供される試剤の量は化合物[51] 1当量に対して、化合物 [52] の塩酸塩又は硫酸塩は 1~5当費、塩基は1~10当量が望ましいが、反応の 状況に応じて任意に変化させることができる。

【0308】塩基としては、例えば炭酸カリウム又は炭 酸ナトリウム等の金層炭酸塩類、酢酸カリウム又は酢酸 ナトリウム等の金属酢酸塩類、トリエチルアミン、ジメ

2/16/2005

(150)

特闘2002-308857

298

7 - ウンデセン等の有機塩基が挙げられる。 【0309】溶媒としては、例えばメタノール、エタノール等のアルコール領、テトラヒドロフラン等のエーテル類、N-ジメチルホルムアミド等のアミド領、水 *

297

* 敢いはそれちの混合物が挙げられる。 【0310】<製造法9> 【0311】 【化20】

【0312】(式中、Y. R¹. R¹. R¹. R¹. R¹及びR¹は前記と同じ意味を衰し、R¹゚及びR¹゚は、各々、水素原子又はアルキル基を衰す。この場合、Yは前記と同じ意味の置換基群々より選択される、1~5個までの同一又は钼異なる基で置換されていてもよい。)一般式[57]で表される本発明化合物は、本発明化合物[50]と塩化チオニル[54]とを溶媒中又は無溶媒中で反応させて化合物[55]を製造した後、化合物[55]と化合物[56]とを溶媒中又は無溶媒中、反応させることにより製造することができる。

【0313】[50]から[55]の反応は、通常、反応温度0~100℃で10分~24時間反応させる。 【0314】反応に供される試剤の墨は化合物[50] 1当量に対して、塩化チオニル[54]1~100当置 が設ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させるこ※30

※とができる。溶媒としては例えばジクロロメタン又はクロロホルム等のハロゲン化炭化水素類。ジェチルエーテル又はテトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン又はトルエン等の芳香族炭化水素類が挙げられる。

20 【0315】[55]から[57]の反応は、通常、反応温度(0~100℃で10分~24時間反応させる。 【0316】反応に供される試剤の量は化合物[55] 1当量に対して、化合物[56]1~100当量が望ま しいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。溶媒としては例えば[50]から[55]の反応と同様なものが挙げられる。

【0317】<製造法10>

[0318]

[ft21]

[0319] (式中、2. R¹. R

一般式 [59]で表される本発明化合物は、本発明化合物 [38] と化合物 [58] とを溶媒中で反応させることにより製造することができる。

【0320】この反応は通常、反応温度0~100℃で 10分~24時間反応させる。

【0321】反応に供される試剤の量は化合物 [38] 1当量に対して、化合物 [58] 1~2当置が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることができる。溶媒としては、、例えばジオキサン又はテトラヒド ロフラン (THF) 等のエーテル類。ジクロロエタン、 四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼン等の ハロゲン化炭化水素類、N、N - ジメチルアセトアミ ド、N、N - ジメチルホルムアミド又はN - メチルー2 40 - ビロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキンド又 はスルホラン等の硫黄化合物、アセトン又は2 - ブタノ ン等のケトン類。アセトニトリル等のニトリル類。水或 いばこれらの混合物が挙げられる。

【0322】<製造法11>

[0323]

[ft22]

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

(151)

特闘2002-308857 300

【0324】(式中、Y. R*, R*, R*, R*, R*)及 びR*は前記と同じ意味を表し、R**はアルキル基、ハ ロアルキル基。シクロアルキル基、シクロアルキルアル キル墓、アルケニル基、アルキニル墓、アルコキシカル ル基、又は置換されていてもよいベンジル基を表す。こ の場合、Yは前記と同じ意味の置換差群々より選択され る。1~5個までの同一又は相異なる基で置換されてい てもよい。)

一般式[61]で表される本発明化合物は、本発明化合 物[47]と化合物[60]とをアゾ化合物とトリフェ ニルホスフィンの存在下、溶媒中で反応させる公知の方 法(Synthesis,1-28(1981))に進じて製造することがで * 4.

【0325】との反応は通常、反応温度0~100℃で 20 挙げられる。 10分~24時間反応させる。

【0326】反応に供される試剤の量は化合物[47] 1 当量に対して、化合物 [60] 1~1.5 当置、アゾ *

【0331】(式中、X'、n. R'. R'. R'. R'. R'、R'及びZは前記と同じ意味を表し、mは1~4の 整数を表す。との場合、ビラゾール頃の3位の炭素原子 30 は、前記と同じ意味の置換基群なより選択される基で置 換されていてもよい。}

一般式[63]で表される本発明化合物は、本発明化合 物【62】を塩華存在下溶媒中で反応させることにより 製造することができる。

【0332】この反応は通常、反応温度0~120℃で 10分~24時間反応させる。

【0333】反応に供される試剤の量は一般式[62] で表される化合物1当量に対して、塩基1~3当量が望 できる。

【0334】塩基及び溶媒としては、製造法3と同様な ものが挙げられる。

【0335】尚、製造法2及び製造法4~12記載のス ルフィド化合物は、製造法 1 記載の方法で酸化すること によりスルホキシド体及びスルホン化合物を製造するこ とができる。

[0336]

【実能例】次に、実施例をあげて本発明化合物の製造 法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化 50 ルチオ) -5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン2、

* 化合物1~1,5 当量、トリフェニルホスフィン1~1、 5当量が望ましいが、反応の状況に応じて任意に変化さ せることができる。

【0327】溶媒としては、例えばジオキサン又はテト ボニルアルキル基、置換されていてもよいへテロアルキ 10 ラヒドロフラン (THF) 等のエーテル領、ジクロロエ タン、四塩化炭素、クロロベンゼン又はジクロロベンゼ ン等のハロゲン化炭化水素類、N,N-ジメチルアセト アミド、N.Nージメチルホルムアミド又はNーメチル -2-ピロリジノン等のアミド類、ジメチルスルホキシ ド又はスルホラン等の硫黄化合物、ベンゼン、トルエン 又はキシレン等の芳香族炭化水素類。アセトニトリル政 いはとれらの混合物等が挙げられる。

> 【0328】アゾ化合物としては、例えばアゾジカルボ ン酸ジェチル又はアゾジカルボン酸ジイソプロビル等が

【0329】<製造法12>

[0330]

[化23]

合物の製造中間体の製造法も併せて記載する。 【0337】<実施例1>

3-(5-クロロー1-フェニル-3-トリフルオロメ チルー1日-ビラゾール-4-イルメチルチオ)-5. 5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物香 号3-0001)の製造 3-メチルスルホニル-5、5-ジメチル-2-インオ キサゾリン2.3g(13.1ミリモル)のN.N-ジメチ ルホルムアミド20m1溶液に、水硫化ナトリウム水和 物2.1g(純度7()%、26.2ミリモル)を加え2時間 擬拌した。その後、無水炭酸カリウム1.8g(13.1 ミリモル)。ロンガリット2.0g(13.1ミリモル) 及 ましいが、反応の状況に応じて任意に変化させることが 40 び4-プロモメチル-5-クロロ-1-フェニル-3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾール3.6g(10. 5ミリモル)を加え、さらに室温で15時間搬拌した。 反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出し た。得られた有機圏を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マ グネンウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシ リカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサ ン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶 (融点8 9~90℃) の3~(5~クロロ~1~フェニル~3~ トリフルオロメチルー 1 H‐ピラゾールー4 ーイルメチ (152)

特闘2002-308857

302

7g(収率65,5%)を得た。

 1 H-NMR(CDC]₂/TMG, δ (ppm)) : 7.55-7.50(5H, m), 4.33 (2H, s), 2.83(2H, s),1.45(6H, s)

301

【()338】<実施例2>

3-(5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメ チルー1日-ビラゾール-4-イルメチルスルホニル) - 5、5 - ジメチル - 2 - イソオキサゾリン(本発明化 台物番号3-0002)の製造

3-(5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメ チルー1H-ピラゾールー4ーイルメチルチオ)-5,5 10 ニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾール3 ージメチルー2-イソオキサゾリン0,48(1,0ミリ モル)のクロロホルム 15 m 1 溶液に、氷冷下、m-ク ロロ過安息香酸(),63g(純度70%,2,6ミリモル) を加え、室温で22時間捌拌した。反応終了後、反応終 液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機 層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム 水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシ ウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、析出した結晶を ヘキサンで洗浄し、白色結晶(融点132~133℃) の3-(5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロ メチルー 1H-ピラゾールー4-イルメチルスルホニル) -5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン()、4g (収率83.2%)を得た。

³ H-NMR(CDCl₂/TMS, δ (ppm)): 7.60-7.51(5H, m), 4.73 (2H, s), 3.14(2H,s), 1.53(6H, s)

【0339】<実施例3>

3-(5-グロロー1-メチル-3-フェニルー1日-ピラゾールー4ーイルメチルスルフィニル)ー5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3 -0003)の製造

3-(5-クロロー1-メチルー3-フェニルー1日-ピラゾールー4ーイルメチルチオ) - 5.5 - ジメチル クロロホルム30m!溶液に、水冷下、m-クロロ過安 息香酸().87g(純度70%、3.54ミリモル)を加 え、室温で1時間機拌した。反応終了後、反応溶液を水 中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜 硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液 及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで 乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラ 40 ムクロマトグラフィー(展開恣媒:ヘキサン-酢酸エチ ル混合溶媒)で精製し、透明アメ状物質の3-(5-クロ ロー1ーメチルー3ーフェニルー1Hーピラゾールー4 -イルメチルスルフィニル) -5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(0.48g(収率53.9%)を得た。 1 H-NMR(CDC), /TMG, δ (ppm)): 7.63-7.60 (2H, m) . 7.4 8-7.37(3H, m), 4.29(2H, q), 3.91(3H, s), 3.12(1H, d), 2.79(1H, d), 1.41(3H, s), 1.35(3H, s)

【0340】<実施例4>

3-トリフルオロメチル-1日-ピラゾール-4-イル メチルチオ)ー 2ーイソオキサゾリン (本発明化合物番 号3-0021)の製造

5,5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2ーイソオ キサゾリン (本発明化合物番号2-1) 18.7 g(10 5、7ミリモル)のN,Nージメチルホルムアミド300 m 1 溶液に、水硫化ナトリウム水和物 9.3 g (純度 7 0 %. 116.3ミリモル)を加え2時間攪拌した。反応系 を氷冷し、4-プロモメチル-5-フルオロー1-フェ ().3g(93,8ミリモル)のN.N-ジメチルホルムア ミド200ml溶液を加え、さらに0°Cで30分間緩搾 した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで 抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水 硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残 渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物 質の5,5-ジメチル-3-(5-フルオロー1-フェニ ルー3ートリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4ー 20 イルメチルチオ》 - 2 - イソオキサゾリン13,11g (収率37.4%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TNG &(ppm)): 7.65-7.39(5H, m), 4.24(2H, s), 2.81(2H, s), 1.43(6H, s) 【0341】<実施例5>

5,5-ジメチルー3-(5-エチルチオー1-フェニル -3-トリフルオロメチル-1H-ビラゾール-4-イ ルメチルチオ) -2-イソオキサゾリン(本発明化合物 香号3-0022)の製造

エタンチオール().25g(4.0)ミリモル)のN,Nージ 30 メチルホルムアミド 10 m 1 溶液に、水酸化ナトリウム 0.2g(4.0ミリモル)、水1m1を加え、室温で3 0 分間規控した。5.5-ジメチル-3-(5-ブルオロ -1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラ ゾールー4ーイルメチルチオ) -2-イソオキサゾリン 5g(1.4ミリモル)のN,Nージメチルホルム アミド5m!溶液を加え、さらに1時間撹拌した。反応 終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。 得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネ シウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、5,5-ジメ チルー3ー(5ーエチルチオー1ーフェニルー3ートリ フルオロメチルー1日-ビラゾール-4-イルメチルチ オ) -2-イソオキサゾリン(1.6g(収率100%) を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TNS 8(ppm)): 7.62-7.47(SH, m), 4.44(2H, s), 2.83(2H, s), 2.50(2H, q), 1.45(6 $H, s), 1.02(3H, \tau)$

【()342】<実施例6>

5、5-ジメチルー3-(5-エチルスルホニルー1-フ ェニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー 5、5 ージメチルー3 - (5 - フルオロー1 - フェニルー 50 4 - イルメチルスルホニル) - 2 - イソオキサゾリン

2/16/2005

(153)

特闘2002-308857

(本発明化合物番号3-0004)の製造

5,5-ジメチル+3-(5-エチルチオー1-フェニル -3-トリフルオロメチル-1日-ピラゾール-4-イ ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、氷冷下、m -クロロ過安息香酸 1.7g(純度70%、6.7ミリモ ル)を加え、窒温で16時間機拌した。反応終了後、反 応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた 有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリ ウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、魚水臓酸マグ 10 1 5 1 °C) の5,5 - ジメチルー 3 - (5 - ジメチルアミ ネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結 晶をヘキサンで洗浄し、淡黄色結晶(融点158~16 () ℃) の5 .5 - ジメチル - 3 - (5 - エチルスルホニル - 1 - フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラ ゾールー4ーイルメチルスルホニル) -2-イソオキサ ゾリン(0.6g(収率93.0%)を得た。

303

(*H-NNR値(CDCT),/TMS &(ppm)): 7.58-7.54(5H, m), 5.16(2H, s), 3.18(2H, s), 3.15(2H, q),1.55(6H, $5),1.24(3H, \tau)$

【0343】<実施例7>

5、5-ジメチルー3-(5-ジメチルアミノー1-フェ ニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4 - イルメチルチオ) - 2 - イソオキサゾリン(本発明化 台物番号3-0023)の製造

5,5-ジメチルー3-(5-ブルオロー1-フェニル -3-トリフルオロメチル-1月-ピラゾール-4-イ ルメチルチオ) -2-イソオキサゾリン().5g(1. 3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10ml 容液に、ジメチルアミン40%水溶液0.8g(6.7ミ メチルアミン40%水溶液3.0g(26.6ミリモル) を加え、さらに9時間搬針した。反応終了後、反応溶液 を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を 食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し た。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロ マトグラフィー(展開溶媒: ヘキサン-酢酸エチル混合 溶媒)で錆製し、5,5ージメチルー3-(5-ジメチル アミノー1ーフェニルー3ートリフルオロメチルー1日 ーピラゾールー4ーイルメチルチオ) -2-イソオキサ ゾリン(0.4g(収率80.6%)を得た。

(*H-NNR値(CDC)。/TNG ら(ppm)): 7.58-7.38(SH, m), 4.35(2H, s), 2.82(2H, s), 2.77(6H, s), 1.45(6 H, s)

【①344】<実施例8>

5、5-ジメチルー3-(5-ジメチルアミノー1-フェ ニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4 - イルメチルスルホニル》 - 2 - イソオキサゾリン(本 発明化合物番号3-0005)の製造

5.5-ジメチルー3-(5-ジメチルアミノー1-フェ ニルー3~トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4 50 ージメチルー2-イソオキサゾリン19.8g(53.4

−イルメチルチオ) −2−イソオキサゾリン0,4 g (1.1ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、氷冷 下、m-クロロ過安息香酸(),7g(純度70%、2,7 ミリモル)を加え、室温で20時間観拌した。反応終了 後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得 られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素 ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫 酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出 した結晶をヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点150~ ノー1-フェニルー3ートリフルオロメチルー1Hーピ ラゾールー4-イルメチルスルホニル) -2-イソオキ サゾリン(0,2g(収率52,0%)を得た。

(1H-NNR値(CDC), /TMG & (ppm)): 7.61-7.38(5H, m), 4.75(2H, s), 3.13(2H, s), 2.76(6H, s), 1.53(6 H, s)

【0345】<実施例9>

3-(1-t-ブチルー5-クロロー3-トリフルオロメ チルー1 Hーピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5、5 20 ージメチルー2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号 3-0006) の製造

5,5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2-インオ キサゾリン24、1g(136.0)ミリモル)のN、Nージ メチルホルムアミド200ml溶液に、水硫化ナトリウ ム21.8g(純度70%、272.5ミリモル)を加え1 時間捌拌した。その後、無水炭酸カリウム18.8 g(1 ミリモル)を加え、更に2時間捌針後、4-プロモメチ ルー1-tert-プチルー5-クロロー3-トリフルオロ リモル)を加え、封管で100℃で9時間機拌した。ジー30 メチルー1日-ビラゾール40g (125ミリモル)を氷 冷下加えた。その後、室温で2時間搬拌し、反応終了確 認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得 られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグ ネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリ カゲルカラムクロマトグラフィー(展開密媒:ヘキサン -酢酸エチル混合溶媒)で精製し、淡桃色結晶(融点7 9.0~81.0°C)の3-(1-tert-ブチル-5-クロ ロー3ートリフルオロメチルー1 H-ビラゾールー4ー イルメチルチオ)-6、5-ジメチル-2-イソオキサゾ リン23.0g(収率57.1%)を得た。

> (*H-NAR値(CDC), /TNG &(ppm)): 4.24(2H, s),2.80 (2H,s),1.71(9H, s), 1.43(6H, s)

【0346】<実施例10>

3-(5-クロロー3-トリフルオロメチルー1日ービ ラゾールー4ーイルメチルチオ)-5,5ージメチルー2 - イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0007)

3-(1-t-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメ チルー1 H - ビラゾール -4 - イルメチルチオ) -5 ,5

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

2/16/2005

(153)

(本発明化合物番号3-0004)の製造

5,5-ジメチル-3-(5-エチルチオ-1-フェニル - 3 - トリフルオロメチル - 1 日 - ピラゾール - 4 - イ ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、氷冷下、m -クロロ過安息香酸1.7g(純度70%、6.7ミリモ ル)を加え、窒温で16時間撮評した。反応終了後、反 応溶液を水中に注ぎクロロホルムで独出した。得られた 有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリ ウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水確酸マグ 10 ネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出した結 晶をヘキサンで洗浄し、淡黄色結晶(融点158~16 ()°C) の5.5 - ジメチル - 3 - (5 - エチルスルホニル -1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラ ゾールー4ーイルメチルスルホニル》 -2-イソオキサ ゾリン0.6g(収率93.0%)を得た。

303

(*H-NAR値(CDC),/TRG &(ppm)): 7.58-7.54(5H, m), 5.16(2H, s), 3.18(2H, s), 3.15(2H, q),1.55(6H, 5),1,24(3H, t)

【0343】<実施例7>

5.5-ジメチルー3-(5-ジメチルアミノー1-フェ ニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4 - イルメチルチオ) - 2 - イソオキサゾリン(本発明化 台物番号3-0023)の製造

5、5ージメチルー3ー(5ーフルオロー1ーフェニル -3-トリフルオロメチル-1月-ピラゾール-4-イ ルメチルチオ) -2-イソオキサゾリン().5g(1. 3ミリモル)のN.N-ジメチルホルムアミド10ml 密波に、ジメチルアミン40%水溶液0.8g(6.7ミ リモル〉を加え、封管で100℃で9時間機拌した。ジ 30 メチルアミン40%水溶液3.0g(26.6ミリモル) を加え、さらに9時間機針した。反応終了後、反応溶液 を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を 食塩水で洗浄した後、魚水硫酸マグネシウムで乾燥し た。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロ マトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチル混合 密媒)で錯製し、5,5ージメチルー3-(5-ジメチル アミノー1-フェニルー3-トリフルオロメチルー1日 ビラゾールー4ーイルメタルチオ) -2ーイソオキサ ゾリン(0.4g(収率80.6%)を得た。

(1H-NAIR値(CDC)。/TMS & (ppm)): 7.58-7.38(5H, m), 4.35(2H, s), 2.82(2H, s), 2.77(6H, s), 1.45(6 H, 5)

[()344] <実施例8>

5、5-ジメチルー3-(5-ジメチルアミノー1-フェ エルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4 - イルメチルスルホニル》 - 2 - イソオキサゾリン (本 発明化合物香号3-0005)の製造

5.5-ジメチルー3-(5-ジメチルアミノー1-フェ ニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4~50~ージメチルー2-イソオキサゾリン19.8g(53.4

304

ーイルメチルテオ) -2-イソオキサゾリン0.4 g .(1,1ミリモル)のクロロボルム10m1溶液に、氷冷 下、m-クロロ過安息香酸().7g(純度7()%、2.7 ミリモル)を加え、室温で20時間機拌した。反応終了 後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで拍出した。得 られた有機圏を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素 ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫 酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、析出 した結晶をヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点150~ 151℃) の5、5-ジメチル-3-(5-ジメチルアミ ノー1-フェニルー3-トリフルオロメチルー1H-ピ ラゾールー4-イルメチルスルホニル) -2-イソオキ サゾリン(),2g(収率52,0%)を得た。

(1H-NAR値 (CDC), /TMS & (ppm)): 7.61-7.38(5H, m), 4.75(2H, s), 3.13(2H, s), 2.76(6H, s), 1.53(6 H, 5)

【()345】<実施例9>

3-(1-t-ブチルー5-クロロー3-トリフルオロメ チルー1日-ビラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5 20 ージメチルー2 - イソオキサゾリン(本発明化合物番号 3-0006)の製造

5.5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2ーインオ キサゾリン24.1g(136.0ミリモル)のN,Nージ メチルホルムアミド200m l 溶液に、水硫化ナトリウ ム21.88(純度70%、272.5ミリモル)を加え1 時間掛拌した。その後、無水炭酸カリウム18,8%(1 $36.2 \le 9 \le 1.08 (136.2)$ ミリモル)を加え、更に2時間攪拌後、4-プロモメチ ルー1-tert-ブチルー5-クロロー3-トリフルオロ - メチルー1目 - ピラゾール40g(125ミリモル)を氷 冷下加えた。その後、室温で2時間微拌し、反応終了確 認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得 られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水罐酸マグ ネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリ カゲルカラムクロマトグラフィー(展開密媒:ヘキサン 一酢酸エチル混合溶媒)で精製し、淡桃色結晶(融点7 9.0~81.0℃)の3-(1-tert-ブチルー5-クロ ロー3-トリフルオロメチルー1日-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾ 40 リン23.0g(収率57.1%)を得た。

(1H-NAR値(CDC), /TNG & (ppm)): 4.24(2H, s),2.80 (2H,s),1.71(9H, s), 1.43(6H, s)

【0346】<実施例10>

3-(5-クロロー3-トリフルオロメチルー1 日ービ ラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2 ーイソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0007)

3-(1-t-プチルー5-クロロー3-トリフルオロメ チルー1日-ビラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5

特闘2002-308857

306

305

ミリモル)を25% 臭化水素 一酢酸溶液 170 m 1 に加え、40~50°Cで、2時間機搾した。反応終了暗認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、魚水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、淡黄色結晶(融点 120.0~122.0°C)の3~(5-クロロー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン12.0°C(収率60.6%)を得た。

【()347】<実施例11>

3-(5-クロロー1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1日-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0008)及び3-(3-クロロー1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0009)の製造

3-(5-グロロー3-トリフルオロメチルー1日ービ ラゾールー4-イルメチルチオ)-5.5-ジメチルー2 ーイソオキサゾリン2.3g (7.3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド50m!溶液に、無水炭酸カリウ ム3、1g(22、5ミリモル)を加え、クロロジフルオロ メタンを反応溶液に吹き込み、130~140℃で3時 間捌拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢 酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩水 で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。凝圧下溶 娘を留去し、残濫をシリカゲルカラムクロマトグラフィー30 ー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で錯製 し、淡黄色結晶(融点41.0~42.0℃)の3-(5-クロロー1ージフルオロメチルー3ートリフルオロメチ ルー1頁-ピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5,5ー ジメタルー2-イソオキサゾリン0,69g(収率25. 8%)および白色粉末(融点89.0~90.0℃)の3~ (3-クロロー1ージフルオロメチルー5-トリフルオ ロメチルー1H-ピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー 5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(),54g(収 率2().2%)を得た。

[0348]3-(5-クロロ-1-ジフルオロメチル-3-トリフルオロメチル-1H-ビラゾール-4-イルメチルチオ)-5、<math>5-ジメチル-2-4ソオキサゾリン

ルオロメチルー1日ーピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン

(*H-NNR値(CDC)。/TNG & (ppm)) 7.19(1H, t),4.28(2

【 0 3 4 9 】 < 実施例 1 2 > 3 - (5 - クロロー 1 - ジフルオロメチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イルメチルスルホニル) - 5 , 5 - ジメチル - 2 - イソオキサゾリン (本発明化合物番号 3 - 0 0 1 0) の製造 3 - 45 - クロロー 1 - ジフルオロメチル - 3 - トリフ

H, s), 2.80(2H,s), 1.44(6H, s)

3-(5-クロロー1-ジフルオロメチル-3-トリブ ルオロメチルー1日-ピラゾールー4-イルメチルチ オ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0.69 g(1.9ミリモル)のクロロホルム20m1溶液に、氷 冷下、m-クロロ過安息香酸1.4g(純度70%,8. 1ミリモル)を加え1時間撹拌した。その後、さらに室 温で 1 2 時間捌拌した。反応終了確認後、反応溶液を水 に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫 酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、 水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム で乾燥した。 減圧下溶媒を留去し、得られた固体を n -ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点126,0~127. 0℃)の3 - (5 - クロロー1 - ジフルオロメチルー3 -20 トリフルオロメチルー 1 H-ピラゾールー4 ーイルメチ ルスルホニル)-5、5 -ジメチル-2-インオキサゾリ ン()、4g(収率53.3%)を得た。

【0350】<実施例13>

3-(3-クロロ-1-ジフルオロメチル-5-トリフルオロメチル-1H-ピラゾール-4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0011)の製造

3-(3-クロロー1-ジフルオロメチル-5-トリフ ルオロメチルー 1 Hーピラゾールー4 ーイルメチルチ オ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(),54 g(1.5ミリモル)のクロロホルム20m1溶液に、氷 冷下、m-クロロ過安息香酸1.1g (純度70%, 6、 4ミリモル)を加え1時間撹拌した。その後、さらに室 湿で12時間攪拌した。反応終了確認後、反応溶液を水 に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫 酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、 水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム 40 で乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し,白色粉末(融点138.0~137. ()*C)の3 - (3 - クロロー 1 - ジフルオロメチルー5 -トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメチ ルスルホニル)-5、5-ジメチル-2-イソオキサゾリ ン0.478(収率79.7%)を得た。

(1 H-NMR館(CDC1,/TNS δ (ppm)): 7.23(1H,t),4.71 (2H, s),3.11(2H,s),1.53(6H, s)

【0351】<実施例14>

5、5 - ジメチルー3 - (3 - メトキシー1 - メチルー5 50 - トリフルオロメチルー1 H - ピラゾールー4 - イルメ (155)

特闘2002-308857

303

チルチオ) -2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号 3-0024)の製造

307

5,5-ジメチルー3-エチルスルホニルー2-イソオ キサゾリン3,3g(17,3ミリモル)のN,N-ジメチ ルボルムアミド10m!溶液に、水硫化ナトリウム水和 物3.18(純度70%、22.0)ミリモル)を加え2時間 機拌した。その後、魚水炭酸カリウム3.1g(22.0) ミリモル)。ロンガリット2.7g(17.5ミリモル) 及 び4-クロロメチルー3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチルー1H~ピラゾール4:0g(17. 5ミリモル)を加え、さらに室温で2時間搬針した。反 応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出し た。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マ グネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシ リカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒: ヘキサ ン一酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5,5-ジメチルー 3-(3-メトキシー1-メチル-5-トリフルオロメ チルー1日-ピラゾール-4-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン2,8g(収率52,0%)を得た。 【0352】<実施例15>

5,5ージメチルー3ー(3ーヒドロキシー1ーメチルー 5-トリフルオロメチル-1日-ピラゾール-4-イル メチルチオ) -2-イソオキサゾリン(本発明化合物番 号3-0025)の製造

25%臭化水素酸酢酸溶液20mlに5,5-ジメチル -3-(3-メトキシー1-メチルー5-トリフルオロ メチルー1月-ビラゾールー4-イルメチルチオ)-2 ーイソオキサゾリン3.3g(10.6ミリモル)を加え、 50℃で3時間搬拌した。反応終了後、反応溶液減圧下 た結晶を遮取し水洗後乾燥し、目的とする5.5-ジメ チルー3-(3-ヒドロキシー1-メチルー5-トリフ ルオロメチルー 1 目 - ピラゾール - 4 - イルメチルチ オ) -2-イソオキサゾリン3.1g (収率96.0%) を得た。

【0353】<実施例16>

5、5ージメチルー3ー(3ーエトキシー1ーメチルー5 **ートリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメ** チルチオ) -2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号 3-0026)の製造

5,5ージメチルー3ー(3ーヒドロキシー1ーメチルー 5-トリフルオロメチル-1目-ピラゾール-4-イル メチルチオ) -2-イソオキサゾリン(0.30g(1.0) ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド10m1溶液 に無水炭酸カリウム(0.20g(1.3ミリモル)及びヨウ 化エチル0.20g(1.5ミリモル)を加え、50℃で3 時間開拌した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸 エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留 去し、目的とする5,5-ジメチルー3-(3-エトキシ 50 0(3H,s), 2.78(2H,s), 1.42(6H, s)

- 1 - メチル - 5 - トリフルオロメチル - 1 日 - ピラゾ ールー4ーイルメチルチオ) -2-イソオキサゾリン 0.30g (収率92.0%) を得た。

【0354】<実施例17>

5,5-ジメチル-3-(3-エトキシ-1-メチル-5 ートリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメ チルスルホニル》-2-イソオキサゾリン(本発明化合 物番号3-(0)12)の製造

5,5-ジメチルー3-(3-エトキシ-1-メチルー5 19 ートリフルオロメチルー1 H-ピラゾールー4 ーイルメ $F \mu F T = -2 - 4 \gamma T + 7 \gamma V = 0.30 g(0.92)$ ミリモル)のクロロホルム10m1溶液に、氷冷下、m - クロロ過安息香酸().68g(純度7i)%、2.76ミ リモル)を加え、窓温で5時間搬鉾した。反応終了後、 反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られ た有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナト リウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マ グネシウムで乾燥した。源圧下溶媒を留去し、折出した 箱晶をヘキサンで洗浄し、白色箱晶 (融点124~12 20 5℃) の5,5ージメチルー3-(3-エトキシ-1-メ チルー5ートリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4 - イルメチルスルホニル) -2-イソオキサゾリン(). 24g(収率73.0%)を得た。

(1H-NNR値(CDC),/TMS & (ppm)): 4.50(2H,s), 4.27 (2H,q), 3.86(3H,s), 3.04(2H,s),1.49(6H,s),1.39(3H, τ)

【0355】<実施例18>

5,5-ジメチルー3-(5-フルオロ-1-メチルー3 ートリフルオロメチルー 1 Hーピラゾールー4 ーイルメ 溶媒を留去し、得られた残渣を水中に注いだ。 新出し 30 チルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号 3-0027)の製造

> 5,5-ジメチル-3-メチルスルホニル-2-イソオ キサゾリン21.3g(120.3ミリモル)のN,Nージ メチルホルムアミド200m | 溶液に、水硫化ナトリウ ム19.3g(純度70%、344.6ミリモル)を加え1 時間捌拌した。その後、無水炭酸カリウム18、7g(1 21.0ミリモル), ロンガリット18.6g(120.7 ミリモル)を加え、更に2時間捌針後、4-プロモメチ ルー5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチ 49 ルー1日-ピラゾール31,48(120,3ミリモル)を 氷冷下加えた。その後、室温で2時間搬拌し、反応終了 確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。 得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マ グネシウムで乾燥した。源圧下溶媒を留去し、黄色柚状 物の5,5-ジメチル-3-(5-フルオロ-1-メチル -3-トリフルオロメチル-1H-ビラゾール-4-イ ルメチルチオ) -2-イソオキサゾリン29.0g(収率 90.3%)を得た。

 1 H-NAR 1 CDC17TNG δ 2 CDC127124.24(2H, s), 3.9

309

【0356】<実施例19>

5,5-ジメチルー3-(5-メトキシ-1-メチルー3 トリフルオロメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメ チルチオ)-2-イソオキサゾリン(本発明化合物香号 3-0028)の製造

5、5 - ジメチルー3 - (5 - フルオロー1 - メチルー3 ートリフルオロメチルー 1 Hーピラゾールー4 - イルメ チルチオ)-2-イソオキサゾリン().5g(1.6ミリモ ル)のメタノール20m!溶液に、ナトリウムメトキシ ドウ.77g(4.0ミリモル,28%メタノール溶液)を 10 ロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル焜 加え、還流下、4時間機拌した。反応終了確認後、反応 溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。 得られた有機 層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで 乾燥した。減圧下溶媒を留去し、黄色油状物の5,5-ジメチルー3-(5-メトキシー1-メチルー3-トリ フルオロメチルー1月-ピラゾール-4-イルメチルチ オ)-2-イソオキサゾリン(),5g(収率96,7%)を 得た。

(1H-NNR値(CDC),/TMS &(ppm)):4.26(2H,s), 4.07 (3H,s), 3.72(3H, s), 2.80(2H,s).1.43(6H, s) 【0357】<実施例20>

5,5ージメチルー3ー(5ーメトキシー1ーメチルー3 ートリフルオロメチルー 1 Hーピラゾールー4 - イルメ チルスルホニル) 2 - イソオキサゾリン(本発明化合物 香号3-0013)の製造

5,5-ジメチルー3-(5-メトキシー1-メチルー3 ートリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメ チルチオ)-2-イソオキサゾリン0.5g(1.5ミリモ ル)のクロロホルム20m!溶液に、氷冷下、m-クロ 口過安息香酸1.3g(純度70%, 7.5ミリモル)を 30 加え1時間機料した。その後、さらに室温で12時間機 控した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホ ルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウ ム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で 順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減 圧下溶媒を図去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄 し、白色粉末(融点113.0~114,0℃)の5,5-ジメチルー3-(5-メトキシー1-メチル-3-トリ フルオロメチルー1目-ピラゾール-4-イルメチルス ルホニル)-2-イソオキサゾリン(),31g(収率58、40 3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-ト 2%)を得た。

 $\{^1$ H-NHR値(CDC) $_2$ /TNS δ (ppm)): 4.60(2H,s),4.11 (3H,s),3.79(3H, s),3.10(2H,s),1.51(6H, s)

【0358】<実施例21>

トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメチ ルチオ)-5.5-ジメチル-2-イソオキサゾリン (本 発明化台物番号3-0029)の製造

2-クロロフェノール().448(3.4ミリモル)のN,

リウム0.2g(8.3ミリモル、純度60%)を氷冷下で 加え、1時間攪拌した後、更に5,5ージメチルー3-(5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチル -1H-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-2-イソ オキサゾリン(),7g(2,2ミリモル)を加え、120~ 130℃で5時間機拌した。反応終了確認後、反応溶液 を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を 水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥 した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムク 台溶媒)で縞製し、黄色油状物の3-(5-(2-クロロ フェノキシ)ー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー 1H-ピラゾールー4ーイルメチルチオ)-5.5ージメ チル-2-イソオキサゾリン0.63g(収率66.7%) を得た。

【0359】<実施例22>

3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メチル-3-トリフルオロメチルー 1 H-ピラゾールー 4 -イルメチ ルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリ 20 ン (本発明化合物番号3-0014)の製造

トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4-イルメチ ルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(). 63g(1.5ミリモル)のクロロホルム20ml溶液 に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸1.0g (純度70) %、5.8 ミリモル)を加え1時間撹拌した。その後、さ ろに室温で12時間機拌した。反応終了確認後、反応終 液を水に注ぎクロロホルムで拍出した。得られた有機層 を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水 恣波、水及び食塩水で腐欠洗浄した後、 無水硫酸マグネ シウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、得られた固体 をn - ヘキザンで洗浄し、白色粉末(融点67.0~7 0.0℃)の3-(5-(2-クロロフェノキシ)-1-メ チルー3ートリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4 ーイルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソ オキサゾリン().31g(収率45.7%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 7.50-6.91(4H,m), 4.45(2H,s), 3.71(3H,s), 3.03(2H, s), 1.47(6H, s) 【0360】<実施例23>

リフルオロメチルー 1 日 - ピラゾール - 4 - イルメチル チオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発 明化合物香号3-0030)の製造

トリフェニルボスフィン0.438(1.6ミリモル)のべ ンゼン10m1溶液にシクロペンタノール0.14g (1.6ミリモル), 5,5-ジメチル-3-(5-ヒドロ キシー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピ ラゾールー4ーイルメチルチオ) -2-イソオキサゾリ ン0.5g(1.6ミリモル)、及びアゾジカルボン酸ジェ N-ジメチルホルムアミド30m!溶液に、水素化ナト 50 チルエステル 0.7g(40%トルエン溶液、1.6ミリ

(157)

特闘2002-308857

312

311

モル)を加え、室温で12時間観拌した。反応終了確認 後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得ら れた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネ シウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(展開密媒: ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油状物の3-(5-シクロペンチルオキシー1-メチル-3-トリブ ルオロメチルー 1 日 - ピラゾール - 4 - イルメチルチ オ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0,52 g(収率85.2%)を得た。

【0361】<実施例24>

3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-ト リフルオロメチルー 1 日 - ピラゾール - 4 - イルメチル スルホニル)-5.5-ジメチル-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号3-0015)の製造

3-(5-シクロペンチルオキシ-1-メチル-3-ト リフルオロメチルー1頁-ピラゾール-4-イルメチル チオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン0,5 2g(1,4ミリモル)のクロロホルム20m1溶液に、 氷冷下、m-クロロ過安息香酸 ().85 g (純度7 () %、4.9ミリモル)を加え1時間擬控した。その後、 さらに登温で12時間幾拌した。反応終了確認後、反応 溶液を水に注ぎクロロホルムで拍出した。得られた有機 層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム 水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグ ネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、得られた固 体をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉末(融点113.0~ 114.0°C)の3-(5-シクロベンチルオキシ-1-メチルー3ートリフルオロメチルー1H-ピラゾールー 4 - イルメチルスルホニル) - 5 , 5 - ジメチル - 2 - イ 30 ソオキサゾリン().2g(収率35.5%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TNG S(ppm)): 5.03(1H,br), 4.6 0(2H,s), 3.73(3H,s), 3.05(2H, s), 1.88-1.70(8H,m), 1.50(6H, s)

【0362】<実施例25>

3-(5-シアノー)-メチル-3-トリフルオロメチ ルー1日-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5.5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3 -0031)の製造

ートリフルオロメチルー 1 H - ピラゾールー4 - イルメ チルチオ)-2-イソオキサゾリン(),5 g(1,6 ミリモ ル)のN,N-ジメチルホルムアミド30m!溶液にシア ン化ナトリウム0.2g(4.0ミリモル)を加え、40℃ で1時間規控した。反応終了確認後、反応恣液を水に注 ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および 食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減 圧下溶媒を図去し、黄色油状物の3-(5-シアノー1 ーメチルー3-トリフルオロメチル-1員-ピラゾール -4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオ 50 【0365】<実施例28>

キサゾリンの組化合物().9gを得た。 (1H-NAR値(CDC):/TM5 &(ppm)): 4.30(2H,s),4.08 (3H,s),2.81(2H, s),1.43(6H, s)

【0363】<実施例26>

3-(5-シアノー1-メチル-3-トリフルオロメチ ルー1月-ピラゾールー4-イルメチルスルホニル)-5,5ージメチルー2ーイソオキサゾリン(本発明化合 物番号3-0016)の製造

3-(5-シアノー1-メチル-3-トリフルオロメチ 10 ルー1日-ピラゾールー4-イルメチルチオ)-5,5-ジメタルー2-イソオキサゾリン0,9g(粗化合物)の クロロボルム50m1溶液に、氷冷下、m-クロロ過安 息香酸2.1g(純度70%, 12.2ミリモル)を加え 1時間機拌した。その後、さらに室温で12時間搬拌し た。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルム で抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水 溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次 洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下 溶媒を図去し、得られた固体をn-ヘキサンで洗浄し、 20 白色紛末(融点105.0~108.0℃)の3-(5-シ アノー1ーメチルー3ートリフルオロメチルー1Hーピ ラゾールー4ーイルメチルスルホニル)-5,5-ジメチ ルー2-イソオキサゾリン().43g(収率76.4%)を

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 4.73(2H,5),4.16 (3H,s),3.14(2H, s),1.53(6H, s)

【0364】<実施例27>

3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール -4-イルメチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオ キサゾリン(本発明化合物番号3-0032)の製造 5,5-ジメチルー3-エチルスルホニルー2-イソオ キサゾリン().7g(3.7ミリモル)のN,N-ジメチル ホルムアミド30m!溶液に、水硫化ナトリウム0.6 g(純度?0%、10.7ミリモル)を加え1時間競拌し た。その後、無水炭酸カリウム0.51g(3.7ミリモ ル), ロンガリット()、56g(3,6ミリモル)を加え. 更に2時間鏡鉢後、4-プロモメチル-3.5-ジクロ ロー1-エチルー1H-ビラゾール0,9g(3,5ミリ モル)を氷冷下加えた。その後、室温で2時間撹拌し、 5,5ージメチルー3-(5-フルオロー1-メチルー3 40 反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで拍 出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無 水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開溶 媒: ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色過 明曲状物の3-(3,5-ジクロロー1-エチルー1H-ピラゾールー4ーイルメチルチオ)ー5,5ージメチルー 2-イソオキサゾリン(0.8 g(収率70.8%)を得た。 (1H-NNR値(CDC),/TMS S(ppm)): 4.14(2H, s), 4.1 4(2H, q),2.81(2H,s),1.43(6H, s),1.42(3H, t)

(158)

特闘2002-308857

314

313

3-(3,5-ジクロロ-1-エチル-1H-ピラゾール -4-イルメチルスルホニル)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号3-0017)の 製造

-4-イルメテルチオ)-5.5-ジメチル-2-イソオ キサゾリン(),8g(2,6ミリモル)のクロロホルム2 0 m 1 溶液に、氷冷下、m - クロロ過安息香酸2.0 g (純度70%、11.6ミリモル)を加え1時間機拌し た。その後、さらに窒温で12時間搬拌した。反応終了 10 確認後、反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。 得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水 素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、 魚水碗酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去 し、得られた固体をカーヘキサンで洗浄し、白色粉末 (融点105.0~107.0℃)の3-(3,5-ジクロロ - 1 - エチルー 1 員 - ピラゾール - 4 - イルメチルスル ホニル)-5.5-ジメチル-2-イソオキサゾリン(). 418(収率46.6%)を得た。

(2H, q), 3.05(2H,s), 1.51(6H, s), 1.45(3H,t) 【0366】<実施例29>

3-(5-クロロー3-ジフルオロメチルー1-メチル ジメチルー2ーイソオキサゾリン (本発明化合物番号3 -0020)の製造

5,5-ジメチルー3-エチルスルホニルー2-イソオ キサゾリン1、9 g(10,0 ミリモル)のN.Nージメチ ルポルムアミド30ml溶液に、水硫化ナトリウム水和 物1.2g(純度70%、15.0ミリモル)を加え2時間 30 メチルー5-メチルー3-トリフルオロメチルイソキサ 搬鉾した。その後、無水炭酸カリウム2 .1g(15.0) ミリモル)。ロンガリット2.3g(15.0ミリモル) 及 び4-プロモメチルー5-クロロー3-ジフルオロメチ ルー1ーメチルー1日-ピラゾール2,6g(10),0ミ リモル)を加え、さらに室温で15時間繊維した。反応 終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。 得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネ シウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(展開密媒:ヘキサンー 酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色粘稠性液体(▲11。 40 *°▼=1.5183)の3~(5~クロロ~3~ジブルオ ロメチルー1ーメチルー1Hーピラゾールー4ーイルメ チルチオ) -5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン 2.1g(収率68,0%)を得た。

(1H-NAR値(CDC)。/TNG お(ppm)):6,79(1H.t.)=54,2H z), 4.24(2H,s), 3.85(3H,s),2.80(2H,s),1.42(6H,s) 【0367】<実施例30>

3-(5-クロロー3-ジフルオロメチル-1-メチル - 1 H-ピラゾールー4 - イルメチルスルホニル) -5,5-ジメチルー2-イソオキサゾリン(本発明化合 So 10m | 溶液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸の,8

物番号3-0018)の製造

3-(5-クロロー3-ジフルオロメチルー1-メチル -1H-E = (-1) +ジメチルー2-イソオキサゾリン1.8g(5.8ミリモ ル)のクロロホルム15m | 溶液に、氷冷下、m-クロ 口過安息香酸3,6g(純度70%、14.5ミリモル)を 加え、室温で22時間攪拌した。反応終了後、反応溶液 を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機圏 を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水 溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、新出した結晶をへ キサンで洗浄し、白色結晶 (融点78~79℃) の3-(5-クロロー3-ジブルオロメチルー1-メチルー1 目-ピラゾールー4ーイルメチルスルホニル)-5.5 -ジメチル-2-イソオキサゾリン1,78(収率85. 9%)を得た。

z), 4.60(2H,s), 3.91(3H,s), 3.08(2H,s), 1.51(6H,s) 【0368】<実施例31>

メチルイソキサゾールー4ーイルメチルチオ) -2ーイ ソオキサゾリン (本発明化合物番号4-0003) の製

5.5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2-イソオ キサゾリン(),4g(2,3ミリモル)のN,N-ジメチル ホルムアミド10m!溶液に、水硫化ナトリウム水和物 ①.4g(純度70%、4.6ミリモル)を加え2時間鏝拌 した。その後、炭酸カリウム0.3g(2.3ミリモル)、 ロンガリット()、4g(2、3ミリモル)及び4ープロモ ゾール().5g(1.8ミリモル)を加え、さらに室温で1 4時間観控した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢 敵エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄し た後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を 留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (展開密媒: ヘキサン-酢酸エチル混合密媒)で錯製し、 5,5-ジメチルー3-(5-メチル-3-トリフルオロ メチルイソキサゾールー4-イルメチルチオ) -2-イ ソオキサゾリン().4g(収率7().0%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 4.11(2H, s), 2.7 7(2H, s), 2.54(3H, s),1.42(6H, s)

【0369】<実施例32>

5、5ージメチルー3ー(5ーメチルー3ートリフルオロ メチルイソキサゾールー4ーイルメチルスルボニル) -2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号4-000 1)の製造

5、5ージメチルー3ー(5ーメチルー3ートリフルオロ メチルインキサゾールー4ーイルメチルチオ) -2-イ ソオキサゾリン().4g(1,3ミリモル)のクロロホルム (159)

特闘2002-308857

315

315

g (純度? 0%、3,2ミリモル)を加え、室温で4時間 機絆した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホ ルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウ ム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次 洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下 | 溶媒を図去し、祈出した結晶をヘキサンで洗浄し、白色 結晶 (融点 135~136℃) の5,5 - ジメチルー3 -(5-メチル-3-トリフルオロメチルイソキサゾー ルー4ーイルメチルスルホニル) -2-イソオキサゾリ ン(),4g(収率95,0%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 4.54(2H, 5), 3.1 1(2H, s), 2.61(3H, s), 1.52(6H, s)

【0370】<実施例33>

[(5-クロロー3-メチル-イソチアゾールー4-イ ル)ーメテルチオ]-5,5-ジメラル-2-イソオキサ ゾリン(本発明化台物番号4-0004)の製造 5,5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2-イソオ キサゾリン0,89g(5,00ミリモル)のN,Nージメ チルホルムアミド10m1溶液に、室温で水硫化ナトリ ウム0.82g(純度70%、10.00ミリモル)を加え 2時間観控した。その後反応溶液中に無水炭酸カリウム 0.70g(5.00ミリモル)、ロンガリット0.78g (5.00)ミリモル)及び5-クロロー4-クロロメチル -3-メチルイソチアゾール(),91g(5,0)まりそ ル)を加え、さらに室温で一夜観拌した。反応終了確認 後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層 を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲル カラムクロマトグラフィーで精製し、[(5-クロロ-3 ーメチルーイソチアゾールー4ーイル)ーメチルチオ1ー 30 5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン1,38g(収)率定量的)を得た。

【0371】<実施例34>

[(5-クロロー3-メチルーイソチアゾールー4-イ ル)ーメテルスルホニル] - 5 , 5 - ジメチル - 2 - イソ オキサゾリン (本発明化合物番号4-0002) の製造 1(5-クロロー3-メチルーインチアゾールー4-イ ル)-メデルチオ]-5,5-ジメデル-2-インオキサ ゾリン1,38g(5,00ミリモル)のクロロホルム20 m1溶液に、m-クロロ過安息香酸2、96g(純度70 40 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図 %、12、00ミリモル)を氷冷下で加え、1時間鏝拌 し、さらに室温で一夜撮針した。反応終了後、反応溶液 を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層 を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水 溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲル カラムクロマトグラフィーで精製し、淡黄色粉末(融点 113~114℃) の[(5-クロロ-3-メチル-イソ チアゾールー4ーイル)ーメチルスルホニル]-5,5-ジメチルー2-インオキサゾリン0.65g(収率47. 50 【0374】<実施例37>

()%)を得た。

(1H-NMR値(CDC)₂/TNG &(ppm)) 8.89(1H,s), 4.67(2 H,s), 3.05(2H,s), 2.59(3H,s), 1.51(6H,s) 【0372】<実施例35>

5、5 - ジメチルー3 - [2、5 - ジメチルー4-(1 - メ トキシイミノエチル)ーチオフェンー3ーイルメチルチ オ1-2-イソオキサゾリン(本発明化合物番号2-0) 002)の製造

、10 イルメチルチオ)~5、5~ジメチル~2~イソオキサゾ リン1.0g(3.4ミリモル)のエタノール50m1溶液 8ミリモル)と酢酸ナトリウム()、56g(6、8ミリモ ル)を加え、遠流下、5時間幾絆した。反応終了確認 後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得ら れた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネ シウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(展開恣媒: ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の5,5-ジ 26 メチルー3-[2.5-ジメチルー4-(1-メトキシイ ミノエチル)ーチオフェンー3ーイルメチルチオ]-2-イソオキサゾリン().4 g(36,4%)を得た。 (1H-NMR値(CDC), /TMS & (ppm)): 4.21(2H, 5),3.95

(3H,s),2.76(2H, s),2.38(3H, s),2.34(3H,s),2.13(3H, s),2.34(3H,s),2.13(3H, s),2.34(3H,s),2.13(3H, s),2.34(3H,s),1,42(6H, s)

【0373】<実施例36>

5,5-ジメチル-3-[2,5-ジメチル-4-(1-メ トキシイミノエタル) - チオフェン - 3 - イルメチルス ルホニル]-2-イソオキサゾリン(本発明化合物香号 2-0001)の製造

5、5 - ジメチルー3 - [2、5 - ジメチルー4 - (1 - メ トキシイミノエチル) - チオフェン - 3 - イルメチルチ オ]-2-イソオキサゾリン0、4g(1.2ミリモル)の クロロホルム30m!溶液に、m-クロロ過安息香酸 0.61g(純度70%, 3.5ミリモル)を氷冷下で加 え1時間機拌し、さらに室温で12時間機拌した。反応 終了確認後、反応終液を水に注ぎクロロホルムで抽出し た。得られた有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭 酸水素ナトリウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した 去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展 関溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で錯製し、白 色結晶(融点95.0~96.0℃)の5.5-ジメチルー 3-(4-(1-メトキシイミノエチル-2,5-ジメチ ルーチオフェン・3ーイルメチルスルホニル)-2-イ ソオキサゾリン0.35g(80%)を得た。

(¹H-NAR値(CDC)₂/TNG & (ppm)): 4.79(2H, 5).3.95 (3H,5),2.93(2H, 5),2.42(3H, 5),2.37(3H,5),2.17(3H, s),1.47(6H, s)

(150)

特闘2002-308857

318

5、5 ージメチルー3 ー(4 ートリフルオロメチルーピリ

317

ジン-3-イルメチルチオ>-2-イソオキサゾリン (本発明化合物番号7-0003)の製造 5、5-ジメチルー3-エチルスルホニルー2-イソオ

キサゾリン0.3 g(1.6 ミリモル)のN,N-ジメチル ホルムアミド20m!溶液に、水硫化ナトリウム0.2 68(純度70%、4.6ミリモル)を加え1時間保持し た。その後、無水炭酸カリウム().22g(1.6ミリモ ル), ロンガリット(),25g(1,6ミリモル)を加え、 ロメチルーピリジン().3 g(1.3 ミリモル)を氷冷下加 えた。その後、室温で2時間銀撑し、反応終了確認後、 反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた 有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲル カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸 エチル混合溶媒)で精製し、黄色油状物の5,5-ジメチ ルー3-(4-トリフルオロメチルーピリジン-3-イ ルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン 0.45 g (収率・ 98.9%)を得た。

(*H-NAR値(CDC7,/TNG &(ppm)):8.98(1H,s), 8.70 (1H,d), 7.51(1H,d), 4.47(2H,s), 2.79(2H,s), 1.43(6 H. s)

【0375】<実施例38>

5、5 ージメチルー3 ー(4 ートリフルオロメチルーピリ ジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾ リン(本発明化合物番号?-0001) および5.5-ジメチルー3-(4-トリフルオロメチルーピリジン-N ーオキシドー3ーイルメデルスルホニル)-2-イソオ キサゾリン(本発明化合物番号7-0002)の製造 5,5-ジメチルー3-(4-トリフルオロメチルーピリ ジン-3-イルメチルチオ)-2-イソオキサゾリン 0.45g(1.6ミリモル)のクロロホルム20m!溶 液に、氷冷下、m-クロロ過安息香酸().77g(純度 70%, 4.5ミリモル) を加え1時間機拌した。その 後、さらに室温で12時間捌拌した。反応終了確認後、 反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた 有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液 炭酸水素ナトリ ウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸 マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣を 40 メチルピリミジン-5-イル)-メチルチオ]-2-イソ シリカゲルカラムクロマトグラフィー(周開溶媒:へキ サンー酢酸エチル混合溶媒)で錯製し、淡黄色結晶(融点 77.0~80.0℃)の5,5-ジメチルー3-(4-ト リフルオロメチルーピリジンー3ーイルメチルスルホニ ル)-2-インオキサゾリン(0,06g(収率12,0%) および 白色結晶(融点114.0~118.0℃)の5.5 ージメチルー3-(4-トリフルオロメチルーピリジン -N-オキシド-3-イルメチルスルホニル)-2-イソ オキサゾリン().128(収率23.1%)を得た。

ジン-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾ リン

 $(^{1}H-NAR001 (CDC)_{3}/TRG \delta(ppm)): 8.98(1H,5), 8.84$ (1H,d), 7.64(1H,d), 4.92(2H, s), 3.09(2H,s), 1.52 (6H, 5)

5、5 - ジメチルー3 - (4 - トリフルオロメチルーピリ ジン-N-オキシド-3-イルメチルスルホニル)-2-イソオキサゾリン

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 8.50(1H,s), 8.2 原に 2 時間機絆後、3 ープロモメチルー4 ートリフルオ 10 5(1H,d)、7.59(1H,d)、4.81(2H,s)、3.12(2H,s)、1.53 (6H. s)

-【0376】<実施例39>

5、5 - ジメチルー[(4 - メトキシー6 - トリフルオロ メチルビリミジンー5ーイル)-メチルチオ]-2-イソ オキサゾリン (本発明化合物番号8-0002) の製造 5、5ージメチルー3ーメチルスルホニルー2ーインオ キサゾリン().35g(2.00ミリモル)のジメチルホル ムアミド10m1溶液に、室温で水硫化ナトリウム0. 328(純度70%,4.00ミリモル)を加え2時間競拌 20 した。その後反応溶液中に無水炭酸カリウム0.28g (2.00ミリモル)。ロンガリット0.31g(2.00ミ リモル)及び5-クロロメチル-4-メトキシー6-ト リフルオロメチルビリミジン().45 g(2.00 ミリモ ル)を加え、さらに室温で2時間捌拌した。反応終了確 駆後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。 得られた有機 層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシ ウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲ ルカラムクロマトグラフィーで精製し、5,5ージメチ ルー[(4ーメトキシー6ートリフルオロメチルビリミジ 30 ン-5-イル)-メチルチオ 1-2-イソオキサゾリン 0.55g(収率85.9%)を得た。

(1H-NAR6値 (CDC), /TMS & (ppm)): 8.81(1H,s), 4.44 (2H,d), 4.12 (3H, s),2.81(2H,s), 1.45(6H,s) 【0377】<実施例40>

5、5ージメチルー[(4ーメトキシー6ートリフルオロ メチルピリミジン-5-イル)-メチルスルホニル]-2 イソオキサゾリン(本発明化合物番号8-0001)

の製冶

5、5ージメチルー [(4ーメトキシー6ートリフルオロ オキサゾリン0、55g(1.71ミリモル)のクロロホル 420m!溶液に、氷冷下でm-クロロ過安息香酸1. 05g(純度70%,4.28ミリモル)を加え1時間機枠 し、さらに室温で4時間搬針した。反応終了後、反応終 液を水中に注ぎクロロホルムで抽出した。 得られた有機 圏を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム 水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシ ウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲ ルカラムクロマトグラフィーで精製し、白色羽毛状結晶 5,5ージメチルー3-(4-トリフルオロメチルーピリ 50 (融点175~178℃)の5,5-ジメチルー[(4-

2/16/2005

(161)

特闘2002-308857

320

メトキシー6-トリフルオロメチルビリミジン-5-イ ル)-メテルスルホニル]-2-イソオキサゾリン().4 5g(収率75.0%)を得た。

(1H-NAR6種 (CDC),/TNG &(ppm)): 8.89(1H,s), 5.00 (2H,d), 4.11(3H,s), 3.11(2H,s), 1.53(6H,s) 【0378】<実施例41>

3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イルチオメチル)-2-トリフルオロメチル-6, 7ジ ヒドロー5日-ピラゾロ[5,1-6][1.3]オキサジン (本発明化合物番号3-0033)の製造

水素化ナトリウム0.11g(2.8ミリモル)のN,N-

ジメチルホルムアミド15m!懸濁液に3-[5-クロ ロー1ー(3ーヒドロキシプロビル)-3ートリフルオロ メチルー 1 H‐ビラゾール‐4‐イル‐メチルチオ]‐ **5、5ージメチルー2ーイソオキサゾール()、82g** (2,3ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド5m !溶液を窒温で滴下した。滴下終了後 反応溶液を窒温 で30分線控し、その後100℃に加熱し1時間搬控し た。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチル で抽出した。有機層をクエン酸水溶液、食塩水で洗浄 後、確職マグネシウムで乾燥した。源圧下恣媒を留去 し、3-(5,5-ジメチルー2-インオキサゾリン-3 - (1) +7ジヒドロー5Hーピラゾロ(5,1-b)[1,3]オキサ ジン0.77g(収率100%)を得た。

 1 H-NAR値(CDC),/TMS δ (ppm)): 4.37(2H,t), 4.19 (2H,t), 4.15(2H,s), 2.80(2H,s), 2.31(2H,m), 1.42(6* * H,s) 【0379】<実施例42>

3-(5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン-3-イ ルスルホニルメチル》-2-トリフルオロメチル-6, 7-ジヒドロ-5H-ピラゾロ[5,1-b][1,3]オキ サジン(本発明化合物番号3-0019)の製造 3-(6,7-ジヒドロー3-トリフルオロメチル-5日 -ビラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン-4-イルー メチルチオ)-5,5-ジメチル-2-イソオキサゾリン 10 0.77g(2.3ミリモル)のクロロホルム溶液20m !に、氷冷下、m-クロロ過去息香酸1.25g(純度 70%, 5.1ミリモル〉を加え1時間撹拌した。その 後、さらに室温で12時間搬拌した。反応終了確認後、 反応溶液を水に注ぎクロロホルムで抽出した。得られた 有機層を亜硫酸水素ナトリウム水溶液 炭酸水素ナトリ ウム水溶液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸 マグネシウムで乾燥した。源圧下溶媒を図去し、残渣を シリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、白色粉 末(融点151,0-152,0℃)の3-(5,5-ジメ 20 チルー2ーイソオキサゾリンー3ーイルスルホニルメチ ル) -2-トリフルオロメチルー6、7-ジヒドロー5 H-ビラゾロ[5,1-b][1,3]オキサジン0.36g (収率4.3%)を得た。(*H-NAR値(CDC)。/TMS & (pp m)) :4.47(2H,s), 4.46(2H,t), 4.23(2H,t), 3.09(2H, s), 2.34(2H,m), 1.50(6H, s)

[0380]

【表131】

	R1 R2 R3 R4 R20 R20 R20														
化合物管号	R ¹	R²	R ³	Rª	n	R ⁵	R ⁶	Z 1	R ²²	R ²³	R ²⁴	設点(で) 又は 風折率 (np ²⁰)			
1-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	S	Me	H	И	66-68			
1-0002	Me	Me	H	H	2	H	H	S	CI	Me	н	87-88			
1-0003	Me	Me	H	н	2	н	н	S	H	H	Me	95-97			
1-0004	Me	Me	H	н	2	н	H	\$	Çı	H	н	70-72			
1-0005	Me	Me	K	Н	2	Ħ	H	S	H	H	Ç1	118-119			
1-0006	Me	Me	K	લ	2	H	H	0	H	H	н	阅走不可			
1-0007	Me	Me	H	H	2	Ħ	н	0	H	H	C(=0)0Me	124-125			

[0381]

【表132】

(162) 特闘2002-308857 321 化合物 番号 融点(℃) 又は $R^1 R^2$ R6 Z2 R25 R^{26} \mathbb{R}^{27} 屈折率(00°) 2-0001 Me Me H 2 H H S Me C(=NOMe)Me H Me 95-96 2-0002 Me Me H HOHBS Me C(=NOMe)Me Me 2-0003 Me Me H H 2 H H S H H H 99-101 H 2 H H S H OMe
H 2 H H S CI H
H 2 H H S CI CI
H 2 H H S Me Me
H 2 H H S Me C(=0)Me 2-0004 Me Me H Н 96-97 2-0005 Me Me H 125-127 a 2-0006 Me Me H CI 158-160 2-0007 Mc Me H Me 117-117 2-0008 Me Me H Me 146-148 2-0009 Me Me H H 2 H H S Ph C(=0)Me Mo 1.5730 2-0010 Me Me H 2 H H S Ph C(=NOMe)Me 129-131 Me 2-0011 Me Me H 2 H H S CI C(=0)0Me Ħ CI 157-158 2 H H S CI C(=O)NHMe 2 H H O H H 2-0012 Me Me H Ħ C) 178-180 2-0013 Mc Me H H H 58-61 2-0014 Mc Mc 180-181

[0382] [數133]

(163)

特闘2002-308857

			R	R ²	R	R	S(C	n^ R ²	P —N Res		
								€ ⁶	Z R		
化合物 番号	R ¹	R²	R³	R.4	n	R⁵	R	R ²⁹	R ^{2#}	R ³⁶	陸点(で)又は 弱折率(no ²⁰)
3-0001	Mic	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	Ph	CI	89-90
3-0002	Mic	Me	H	H	2	H	H	CF,	Ph	CI	132-133
3-0003	Me	Мс	H	н	3	Н	H	Ph	Me	CI	测定不可
3-0004	Me	Мe	H	Н	2	H	H	CF ₃	Ph	SO₂Et	158-160
3-0005	Me	Me	H	И	2	Н	H	CF ₃	Ph	N(Me)	150-151
3-0006	Me	Me	H	H	0	н	H	CF ₃	Bu-t	Cı	79-81
3-0007	Me	Me	Н	H	0	н	H	CF,	н	CI	120-122
3-0008	Me	Me	H	Н	0	H	ĸ	CF,	CHF ₂	CI	41-42
3-0009	Me	Me	H	н	0	H	Н	CI	CHF ₂	CF ₃	89-90
3-0010	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CHF ₂	CI CI	126-127
3-0011	Me	Me	H	H	2	H	H	C1	CHF ₂	CF ₃	136-137
		Me	H	H	2	H	H	O Et	Me	CF ₃	124-125
3-0013			H	H	2	H	H	CF ₃	Me	OMe	113-114
3-0014	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Me	O(2-CI)Ph	67-70
3-0015	Me	Me	H	Ħ	2	H	H	CF ₃	Mo	ОРеп-с	113-114
3-0016				H	2	Ð	H	CF ₃	Mc	CN	105-108
3-0017	Me	Me	H	Н	2	Θ	Ð	CI	<u>e</u> r	a	105-107
3-0018				H	2	H	H	CHF ₂	Me	CI	78-79
3-0019				H	2	H		CF ₃	-(CH ₂);O-		l51-152
3-0020				H	- 1		H	CHF ₂	Me	CI	1.5183
3-0021		Мс	H	H	0	H	H	CF ₃ .	Ph	F	
1		Me		H	0	H		CF ₃	Ph	SEt	
3-0023				Н	9	14	H	CF,	Ph	N(Me)2	
3-0024					- 1	H		OMe	Me	CF;	
3-0025				H	1			ОН	Me	CF ₃	
3-0026						H		()Et	Me	CF ₃	
3-0027				H		H		CF,	Me	F	
3-0028					0	H		CF3	Ме	Ohie	
3-0029						Ŋ		CF ₃	Mc	O(2-C1)Ph	
3-0030					- 1	H		CF3	Ме	OPen-c	
3-0031						H	1 .	CF,	Me	CN	
3-0032		•		H	. 1	Н	H	1	Et	CI	
3-0033				H		H		CF ₃	-(CH ₂) ₃ O-		
3-0034	Me	Me	H	H	2	Н	H	CF ₃	}}	CI	138-140

[0383]

【表134】

(164)

325

特闘2002-308857

326

化合物	R	R²	R ³	R ^d	n	R ⁵	R6	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁰	健点(℃)又は 風折率(np**)
3-0035	Me	Me	1)	H	2	н	H	H	Me	CI	105-106
3-0036	Me	Me	H	H	2	H	И	Me	Me	Ме	148-150
3-0037	Me	Me	н	H	2	Э	H	Me	Me .	CI	99-101
3-0038	Me	Me	н	Н	2	н	н	CI	Me	CI	143-145
3-0039	Me	Мe	H	H	2	H	н	CF,	Me	CI	115-116
3-0040	Me	Me	Н	H	2	H	H	Ct	Me	CF ₃	120-122
3-0041	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	F	79-82
3-0042	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ме	OH	90-92
3-0043	Me	Me	H	н	2	Н	H	OMe	Me	CF ₃	125-126
3-0044	Me	Me	Ħ	H	2	H	H	CF ₃	Me	OE:	92-94
3-0045	Me	Me	H	H	2	н	н	CF,	Me	OPr-i	69-71
3-0046	Me	Me	H	H	2	н		CF,	Me	OPr	82-83
3-0047			H	Ħ	2	И		CF,	Me	ОВи-ι	86-89
3-0048			H	ਜ	2	H	H	CF ₃	Me	OBu	61-62
3-0049			H	H	2	H	H	CF,	Me	OHex-c	124-125
3-0050	Me	Μc	H	И	2	H	H	CF ₃	Me	OCH ₂ Pr-c	93-94
3-0051		Me	н	и	2	Ð		CF ₃	Me	OCH ₂ Pen-c	112-113
3-0052			Н	H	2	H		CF ₃	Me	OCH ₂ Hex-c	56-59
3-0053			H	н	2	н	H	CF,		осн₂с≡сн	92-93
3-0054	Mc	Mc	н	Н	2	н	H	CF ₃	Me	оскг,	129-130
3-0055	Me	Nie	H	H	2	H	H	OCHF ₂		CP;	測定不可
3-0056			H		2	H	Н	CF;		OCH ₂ CHF ₂	89-91
3-0057		- 1	a		2	н		CF ₃		OCH ₂ CF ₃	93-95
3-0058					2	H		CF ₃		OCH ₂ CN	1.4872
3-0059					2	н		CF ₃		OCH ₂ Pb	79-81
3-0060			н		2	Ħ		- 1		OPh	122-123
3-0061			H		2	Н		٠, ١		O(3-C1)Pb	測定不可
3-0062			H		_	H		**		O(3-OMe)Ph	1.5059
3-0063	. 1				2	H				0(4-C1)Pb	68-69
3-0064	1 1		H		2	H				O(4-Me)Ph	132-133
3-0065			H		2	H	•	٠,		O(4-OMc)Pb	115-117
3-0066			H		2	H		· 1		OC(=O)Me	130-131
3-0067			H		- 1			٠ ١		SO ₂ Me	168-169
3-0068		1	H		2	H		- 1	5	SEt	100-102
3-0069			H		2	H		· ·		SO ₂ Ei	107-108
3-0070		1	H		2	H	•	CF ₃	3	SO ₂ Ph	166-168
3-0071			- 1		2	9	- 1			Me	105-107
3-0072					2	H				a	127-129
3-0073	Me	Me	H	н	2	H	н	CF ₃	Ei	Cl	111-112

[0384] [表135]

(165)

327

特闘2002-308857

328

化合物 番号	R¹	R²	R)	R ⁴	n	R ³	R°	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁰	股点(で)又は 畑析率(n _p ²⁵)
3-0074	Me	Me	H	H	2	b,	Н	CI	Et	CF ₃	112-114
3-0075	Me	Me	Ħ	н	2	н	H	CF,	Pr-i	CI	157-158
3-0076	Mo	Me	H	H	2	н	H	Cı	Pr-i	CF ₃	135-136
3-0077	Me	Me	н	H	2	н	H	CF ₃	Pī	CI	89-90
3-0078	Me	Me	H	H	2	H	H	CI	Pr	CF,	111-113
3-0079	Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	Bu-t	н	101-103
3-0080	Me	Me	Н	н	2	H	н	CF ₃	Bu-t	CI	118-L19
3-0081	Mc	Mc	Н	н	2	H	н	CF;	Bu-s	CI	110-112
3-0082	Me	Me	Н	ĸ	2	Н	H	CI '	Bu-s	CF ₃	110-111
3-0083	Me	Me	н	H	2	Н	Ð	CF ₃	Bu-i	la .	96-98
3-0084	Me	Me	н	Н	2	H	Н	Cl	Bu-i	CF ₃	140-141
3-0085	Mo	Me	Ħ	н	2	Н	H	CF ₃	Bu	CI	89-90
3-0086	Мс	Mc	H	н	2	H	Н	CI	Bu	CF ₃	108-110
3-0087	Me	Me	H	н	2	Ħ	н	CF ₃	CH₂Ph	CI	132-133
3-0088	Me	Me	Н	н	2	(4	H	Ci	CH ₂ Ph	CF,	118-120
3-0089	Me	Me	н	H	2	H	н	CF ₃	Pen-c	ci c	130-131
3-0090	Mc	Me	н	H	2	H	н	CI	Pen-c	CF ₃	147-148
3-0091	Me	Me	H	н	2	H	н	CF ₃	Hex-c	CI	151-152
3-0092	Me	Me	H	H	2	H	Н	CF,	СН₂Рт-с	CI	93-95
3-0093	Me	Me	H	Н	2	H	н	CI	CH ₂ Pr-c	CF,	129-130
3-0094	Me	Me	H	11	2	н	Н	CF ₃	1-cyclopropylethyl	CI	87-89
3-0095	Me	Мe	H	Ð	2	H	H	CI	1-cyclopropylethyl	CF,	121-123
3-0096	Me	Me	H	н	2	H	H	CF ₃	City(2-Methylcyclopropyl)	CI	102-103
3-0097	Me	Me	н	н	2	H	H	C1	CH ₂ (2-Methylcyclopropyi)	CF,	118-119
3-0098	Me	Me	H	[-]	2	Э	H	CF ₃	CH ₂ Bu-c	CI .	94-96
3-0099	Μe	Me	н	н	2	Ð	H	Cl	CH ₂ Bu-c	CF ₃	141-142
3-0100	Me	Me	H	H	2	H	Н	CF ₃	Ci-l ₂ Pen-c	Cl	127-129
3-0101	Me	Me	H	H	2	H	H	Ci ;	CI4;Pen-c	CF,	146-149
3-0102	Me	Me	Н	н	2	H	H	CF ₃	CH.Hex-c	Cl	152-154
3-0103				H	2	H	H	CI	CH2Hex-c	CF ₃	115-117
3-0104			H	H	2	H	H	CF ₃	CH₂CH=CH₂	Cl	78-80
3-0105			H	H	2	H		Cl	CH₂CH=CH₂	CF ₃	105-106
3-0106				H	2	H	Н	CF ₃	CH ₂ C≡CH	Cl	73-74
3-0107			H	К	2	Н		CI	CH ₂ C≅CH	CF,	108-109
3-0108			Ħ	H	2	H	H	CF₃	СНМеС≡СН	CI	95-96
3-0109				H	2	Н	H	Cl	CHMeC≡CH	CF ₃	116-118
3-0110	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ C≡CMe	Cl	114-115
	Me			H	2	Н	Н	Ci	CH ₂ C≡CMe	CF3	115-116
3-0112	Me	Me	H	Н	2	H	Н	CF ₃	CHF ₂	OMe	72-74

[0385] [表136]

(156)

329

特闘2002-308857

1

化合物	R ¹	R²	R3	R ⁴	n	R3	R°	R ²⁹	R ²⁸	R ³⁶	配点(C)又は 屈折率(n _o ²³)
3-0113	Me	Me	Н	H	2	Н	H.	OMe	CHF ₂	CF,	108-109
3-0114	Me	Mc	H	н	2	H	н	CF ₃	CH2CHF2	CI	99-100
3-0115	Me	Me	H	н	2	н	H	C1	CH ₂ CHP ₂	CF,	107-109
3-0116	Me	Me	н	H	2	Н	H	CF ₃	CH ₂ CF ₃	ຕໍ	135-136
3-0117	Me	Me	н	Н	2	3)	H	CI	CH ₂ CF ₃	CF ₃	112-115
3-0118	Me	Me	Н	H	2	H	H	CF,	CH ₇ OMe	C1	87-89
3-0119	Me	Me	К	H	2	н	Н	Cı	CH ₂ OMe	CF ₃	125-128
3-0120	Me	Me	H	H	2	H	Н	CF ₃	CH ₇ OEt	CI	97-98
3-0121	Me	Мc	H	н	2	Н	H	Cl	CH ₂ OEt	CF ₃	128-129
3-0122	Me	Me	H	H	2	н	H	CF ₃	СН₂СН₂ОН	Cl	79-81
3-0123	Me	Me	H	Н	2	(4	H	CI	CH₂CH₂OH	CF ₃	93-94
3-0124	Me	Me	H	н	2	Æ	H	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OMe	Cl	102-104
3-0125	Me	Me	Н	н	2	H	H	Cl	CH ₂ CH ₂ OM ₀	CF ₃	118-119
3-0126	Me	Me	H	н	2	Н	н	CF ₃	CH ₂ CH ₂ OEt	CI	56-59
3-0127			H	н	2	H	H	CI	CH ₂ CH ₂ OEt	CF ₃	118-119
3-0128			H	H	2	H	H	CF ₃	CH ₂ SMe	CI	103-105
3-0129		1	н	н	2	A		CL	CH ₂ SMe	CF ₃	128-129
3-0130				H	2	H	H	CF,	CH ₂ SO ₂ Me	CI	157-159
3-0131	Me	Me	H	H	2	Ħ		CI	CH₂SO₂Me	CF,	165-166
3-0132	Me	Me	H	H	2	Ħ	Н	CF,	CH2CH2SO2Me	CI	155-157
3-0133	1 1		H	H	2	П	H			CF ₃	166-168
3-0134	Me	Me	H	H	2	Я	н			CI	128-129
3-0135			Н	H	2	н	H		-	CF ₃	117-118
3-0136			H	H	2	H	H	CF,		CI	127-129
3-0137			H	H	2	H	H			CF,	143-145
3-0138				Н	2	Ы			- ' ' -	Cl	173-174
3-0139		1		Н	2	В	Н			CF ₃	182-183
3-0140		1	H	H	2	H		CF,		CI	142-143
3-0141				H	2	H	H			CF,	181-182
3-0142					2	H		-	_ ,	Cl	148-149
3-0143			H	Н	2	H				CF ₃	163-164
3-0144			H	H	2	H		-	• • • •	Cl	89-91
3-0145				H	2	Н				Mc	140-141
3-0146				Н	2	Н				CI	124-125
3-0147				H	2	(4				CI .	(12-113
3-0148			H	Ħ	2	H				CI	122-123
3-0149			H	H	2	H			Ph	C1	116-117
3-0150			H	Н	2	Н		Bu-t		CI	100-102
3-0151	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	H	111-112

[0386]

【表137】

(167)

331

特闘2002-308857

332

化合物	R1	R²	R³	R4	n	R ³	R ⁶	R ²⁹	R ²⁸	R ²⁰⁾	政点(で)又は 屈折率(ロッ ²²)
3-0152	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	Ме	129-132
3-0153	Me	Μe	н	H	z	H	H	CF ₃	Ph	CF ₃	112-113
3-0154	Me	Me	Н	H	2	H	H	CF ₃	Pb	F	90-91
3-0155	Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	Ph	ОМе	104-106
3-0156	Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OEi	129-131
3-0157	Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OPr-i	86-88
3-0158	Me	Me	н	Н	2	H	H	CF ₃	Pla	OPt	117-118
3-0159	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	OBu-1	J05-108
3-0160	Me	Me	H	Н	2	H	H	CF ₃	Ph	OCHF ₁	98-92
3-0161	Me	Me	H	H	2	H	H	CF ₃	Ph	SO ₂ Me	167-168
3-0162	Me	Me	Н	H	2	H	H	CF₃	Ph	CN	113-115
3-0163		Me	Н	H	2	Ħ		CF ₃	(2-CI)Ph	Cl	153-154
3-0164	Мc	Me	H	H	2	H		CF ₃	(3-C1)Ph	Cı	106-107
3-0165	Me	Mc	H	Ħ	2	H	H	CF ₃	(4-C1)Ph	CI	142-143
3-0166	Me	Me	H	H	2	R	Н	CF,	(4-F)Ph	CI	135-138
3-0167	M¢	Me	H	H	2	В	Н	CF,	(4-OMe)Ph	CI	136-138
3-0168	Me	Mc	H	H	2	H	н	CF,	(4-Me)Ph	a	129-130
3-0169	Me	Me	н	H	2	H	H	CF ₃	(4-NO ₂)Ph	CI	145-147
3-0170	Me	Me	н	Ħ	2	Ħ	H	CF ₃	(4-CN)Ph	CI	91-93
3-0171	Me	Me	Н	H	2	н	Н	CF ₃	(4-C(=())Me)Ph	CI	133-135
3-0172	Me	Me	Н	H	2	н	Н	CF ₃	(4-C(=0)0Me)Ph	Ci	121-124
3-0173	Me	Μc	н	H	2	н	H	CF ₃	Pyr mi din-2- y l	CI	148-150
3-0174	Me	Me	H	H	2	H	Н	CF ₃	4,6-Dimethoxypyrmidie-2-yl	CI	117-118
3-0175	Me	Me	н	Н	2	н	H	CF3	SO₂Me	CI	146-148
3-0176	Me	Mo	н	н	2	н	H	CF ₃	SO₂Ph	Cl	145-148
3-0177	Me	Mc	H	H	2	Н	H	CF ₃	C(=0)Mc	Cl	130-131
3-0178	Me	Me	H	Н	2	н		CF3	C(=0)Ph	CI	114-117
3-0179		Me	н	н	2	H	H	CF,	C(=O)OMe	CI	104-106
3-0180		Et	H	Н	2	н		CF ₃	Me	CI	108-110
3-0181	Me	Me	Н		0	H	H	CHF ₂	Ме	CI	1.5183
1			H	H	0	н	H	Ph	Me	CI	76-77
3-0183			H	H	Q	н	H	CF ₃	Bo-t	OMe	1.4831
3-0184			H	H	- 1	H		CF ₃	CH ₂ C(=O)NH ₂	CI	179-180
3-0185	Me	Me	H	H	0	Н	H	Me	Ph	CI	58-60

[0387]

【表138】

	333	(168)		特闘2002-308857 334
	1	R ³ R ³ R ⁴ R ⁵ R ⁵	Fast N Sa,	
	化合物 音号 RI		R ⁶ Z ³ R ³¹ R ³² 製点(又は 気折 (n _p	は 学 <u> </u>
	4-0002 Me 4-0003 Me	Me H H 2 H Me H H 0 H	H O CF ₃ Me 135-1 H S Me CI 113-1 H O CF ₃ Me H S Me CI	
	4-0005 Me 4-0006 Me 4-0007 Me	Me H H 2 H 1 Me H H 2 H 1	H O Me Me 178-1 H O CF3 OEt 89-9 H O Ph Me 81-8	1
[0388]	4-0008 Me		H S Me OEt 109-1 :【表 1 3 9 】	<u>11</u>
] R ⁱ	N S(O) 1 R ²	R84	
	m ~	R ⁴ n R ⁵ R ⁶ Z ⁴	R" R"	这点(TC)又は 折率(n., ²⁶)
	5-0002 Me Me H 5-0003 Me Me H	H 2 H H NMe C	CI Me CI Ex CF ₃ H	114-(15 107-108 142-143
	5-0004 Me Me H 5-0005 Me Me H 5-0006 Me Me H	H2HHNPh C	-(CH ₂) _d - DEt Me DCHF ₂ Me	123-125 1.5397 1.5339
	5-0007 Me Me H 5-0008 Me Me H 5-0009 Me Me H	H2HHNPh C	CF ₃ II CCH ₂ CH=CH ₂ Me CCH ₂ CH=CH ₂ Me	99-101 87-90 1.5702
[0389]			【表140】	

335			•					(169)			•	12 0 0 2 - 3 0 8 8 5 7 336
			Kı-	ð	R ³	R	S(O	R ⁶	N Z5	R ³⁵		
化合物 番号	Ri	R²	R³	R⁴	12	R ⁵	R°	Z ^{\$}	R ¹⁵	R ^{3ti}	股点(℃)又は 屈折率(n _p ²⁰)	
6-0001	Me	Me	Đ)	[-]	2	H	H	NCHF ₂	-∢((H ₂) ₄	測定不可	
6-0002	Me	Me	H	H	2	H	H.	NPb	H	OEi	107-108	
6-0003	Me	Me	H	H	2	H	H	NPh	н	OCHF2	1.5383	
6-0004	Mc	Me	H	H	2	H	H	0	Me	H	100-102	
6-0005	Mo	Me	H	H	0	H	H	NCHF ₂	-(0	`H ₂)₄-	1.5264	

[0390] * * 【表 141】 化合物 番 辱 (他点(*C)又は R² R³ R⁴ R37 R18 R39 R40 n R5 R6 配折率(np20) 7-0001 Me Me H H H CF₃ 77-80 H 7-0002 Mc Me H H 2 H H H CF₃ H H N-oxide 114-116 7-0003 Me Me H H O H H H CF₃ HH 7-0004 Ме Ме Н Н 2 Н Н Ħ H H H 130-131 7-0005 Me Me H H 2 H H Ħ H 14 н N-oxide 166-168 7-0006 Mc Me H H 2 H H Ph CI H H 118-120 7-0007 Mc Me H H 2 H H OMe Ph H 105-106 7-0008 Me Me H H 2 H H a Me H H 115-116 7-0009 Ме ме н н 2 н н OMe Me H H 134-135 7-0010 Me Me H H 2 H H Me H Me H N-oxide 198-199 7-0011 Mc Mc H H 2 H H Ph Ph H Н 161-162 7-0012 Me Me H H 1 H H H H H H 97-99 (2-Chloropyridin-7-0013 Me Me H H O H H H 154-155 3-yl)methylthio

[0391] [数142]

(170)

特闘2002-308857

338

	R ² R ² R ⁴ R ⁴ R ⁴¹													
化合物番号	RI	R²	R³	R'	n	R ⁵	R ⁵	R ⁴¹	R42	R ⁴³	融点(で)又は 屈折率(np ²⁸)			
8-0001	Me	Me	H	H	2	H	H	Н	OMe	CF ₂	175-176			
8-0002	Me	Me	14	H	0	H	н	H	OMe	CF ₃				
8-0003	Me	Me	H	Н	2	H	H	Н	Cl	Cı	119-120			
8-0004	Me	Me	H	H	2	A	Н	Н	OEt	CF ₃	94-95			
8-0005	Me	Me	H	H	2	H	H	Н	OMe	ОМе	186-187			
8-0006	Me	Me	Н	H	2	H	H	Me	OMe	CL3	143-144			
8-0007	Me	Me	H	H	2	Н	Н	OMe	ОМе	CF ₃	144-145			
8-0008	Me	Mc	H	H	2	H	H	SMe	ОМе	CF ₃	160-162			
8-0009	Me	Me	H	H	2	н	н	SO ₂ Me	ОМе	CF.	144-146			
8-0010	М¢	Me	н	H	2	Н	H	NH ₂	OMo	CF ₃	208-209			
8-0011	Me	Me	Н	H	2	Pr-i	н	н	н	CF ₃	112-113			
8-0012	Μo	Me	H	H	0	Pr-i	H	H	H	CF3	1.4986			

337

[0392]

* *【数143】

	$R' \xrightarrow{R^2} R^2$ $C_{N} \xrightarrow{R^2} R^{c}$ $C \xrightarrow{R^2} C \xrightarrow{R^2}$													
化合物 番号	R!	R ²	R3	R ⁴	n	R ^s	R ⁶	γ'	融点(で)又は 風折率(ヵヵ ²⁰)					
9-0001	Me	Me	H	H	2	н	H	Pyridin-2-yl	116-118					
9-0002	Me	Me	H	Ð	2	H	H	Pyridin-2-yl 1-oxide	140-143					
9-0003	Me	Me	H	H	2	Ħ	14	Pyridin-4-yl	133-136					
9-0004	Me	Me	Ħ	H	2	H	H	Pyridia-4-yl 1-oxide	110-113					
9-0005	Me	Me	H	H	2	H	Ħ	1,2,4-Oxadiazol-3-yl	衡定不可					
9-0006	Me	Me	н	H	2	И	Н	3-Phenyl-1,2,4-oxadiazoi-5-yl	153-154					
9-0007	Me	Me	A	H	2	Н	н	3-Benzyl-1,2,4-oxadiazol-5-yl	108-109					
9-0008	Мe	Me	H	H	2	H	H	2-Chlorothiazol-4-yl	110-112					
9-0009	Me	Me	н	U	2	H	H	1,4-Dimethylimidazol-5-yl	163-164					
9-0010	Me	Me	H	H	1	H	н	Pyridin-2-yl	81-82					
9-0011	Me	Me	Н	И	1	н	ſ	Pyridin-4-yl	94-96					
9-0012	Me	Me	H	Ħ)	н		1,4-Dimethylimidazol-5-yl	138-140					
9-0013	Me	Me	H	Н	0	A		1,4-Dimethylimidazol-5-yl	1,5427					

[0393]

【表 1 4 4]

特闘2002-308857

	3	39							340					
	R ¹ R ² R ³ R ⁴ R ⁶ R ⁶ R ⁶ R ⁶ R ⁶													
化合物番号	Ri	R ²	R³	R1	n	Rs	R ⁶	Y ¹	融点(℃)叉は 屈折率(n,²°)					
10-0001	Me	Me	H	H	2	н	Н	Benzimidazol-2-yl	171-174					
10-0002	Me	Me	Н	н	2	Ħ	H	Benzothiophen-2-yl	181-183					
10-0003	Me	Me	H	н	2	H	H	3-Chlorobenzothiophen-2-yl	109-112					
10-0004	Me	Μ¢	H	H	2	Н	H	Benzotriazol-1-y)	206-207					
10-0005				H	2	H	H	1-Methylindazol-4-yl	128-130					
10-0006	Mc	М¢	н	Ħ	2	H	H	Benzothiazol-2-yl	142-143					
10-0007	Me	Мe	Н	14	2	H	H	Benzothiophen-3-yl	188-191					
10-0008			Н	H	2	H	H	5-Chlorobenzothiophen-3-yl	129-130					
10-0009	Me	Me	H	Ħ	2	H	H	Benzoxazol-2-yl	127-129					
10-0010	Me	Me	H	Н	2	H	Ħ	3-Methylbenzothiophen-2-yl	161-163					
10-0011	Me	Me	H	Н	2	H	Н	3-Bromobenzothiophen-2-yl	118-119					
10-0012			H	H	2	H	H	Benzofuran-2-yl	123-124					
10-0013	Me	Me	H	H	2	Н	H	2-Methylbenzofuran-7-yl	135-137					

H Benzothiophen-7-yl

H 1-Methylindazol-7-yl

H 3-Methylbenzofuran-2-yl

H 3-Chloro-1-methylindol-2-yl

10-0014 Me Mc H H 2 H H 3-Bromobenzofuran-2-yl

H 2 H

H 2 H

【()394】(中間体の製造例)

<参考例1>

3-クロロー5、5-ジメチル-2-イソオキサゾリンの製造

10-0017 Me Me H

10-0018 Me

10-0015 Me Me H H 2 H

10-0016 Me Me H H 2 H

Mel H

【0395】<参考例2>

3 - クロロー5 - エチルー5 - メチルー2 - イソオキサ ゾリンの製造

グリオキシル酸アルドオキシム20.6g(231.7ミリモル)の1,2-ジメトキシエタン500m!溶液

に、60℃でN-クロロこはく酸イミド61.9g(463.4ミリモル)を徐々に加えた。加え終わった後、10分間加熱道流した。次に、水冷下、2-メチル-130-ブテン50m1(463.4ミリモル)、炭酸水産カリウム98.9g(1622ミリモル)及び水10m1を加え12時間搬搾した。反応溶液を水中に注ぎn-ヘキサンで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、淡黄色粘調性液体の3-クロロ-5-エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリン13.9g(収率40.6%)を得た。

107-108

95-97

89-90

111-112

162-165

(1H-NAR値(CDCT),/TNG δ(ppm)):2.91(2H,ABq,J=17. 0,Δν=46.1Hz), 1.73(2H,q), 1.42(3H,s), 0.96(3H,τ) 【0396】<参考例3>

3 - ベンジルチオー5,5 - ジメチルー2 - イソオキサゾリンの製造

ベンジルメルカプタン2.8g(22.5ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド50m!溶液に、窒素気流下、無水炭酸カリウム3.2g(23.2ミリモル)及び3-クロロ-5.5-ジメチル-2-イソオキサゾリン3.0g(22.5ミリモル)を加え100℃で2時間緩針した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗50 浄した後、無水磁酸マグネシウムで乾燥した。源圧下溶

(172)

特闘2002-308857

5、5-ジメチルー3-メチルスルホニルー2-イソオ

娘を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ ーで舗製し、黄色油状物質 (屈折率▲n。**▼= 1.55 21) の3-ベンジルチオ-5,5-ジメチル-2-イ ソオキサゾリン3.1g(収率62.0%)を得た。

(1H-NAIR値(CDC)₂/TNS S(ppm)):7.24-7.39(5H,m)、 4.26(2H,s), 2.77(2H,s), 1.40(6H,s)

【0397】<参考例4>

3-(2,6-ジフルオロベンジルスルフィニル)-5 -エチル-5-メチル-2-イソオキサゾリンの製造 3-(2.6-ジフルオロベンジルチオ)-5-エチル -5-メチル-2-イソオキサゾリン4,1g(15,0 ミリモル》のクロロボルム50m!溶液に、氷冷下、m -クロロ過安息香酸4.6g(純度70%、18.8ミリ モル)を加え1時間緩拌した。その後、さらに室温で1 2時間機控した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎり ロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸水素ナ トリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液、水及び食塩水で 順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減 圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグ ラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル複合溶媒) 20 去し、残渣をジイソプロビルエーテルで洗浄し、白色粉 で錯誤し、白色粉末 (融点30℃以下)の3-(2,6 ージフルオロベンジルスルフィニル) -5-エチルー5 ーメチルー2 - イソオキサゾリン 1,5 g (収率34,8 %)を得た。

(1H-NAR6値(CDC):/TMS & (ppm)):7.39-7.28(1H.m)、 7.03-6.94(2H,m), 4.38(2H,s), 3.04(1H,ABq,J=17.2, \triangle $\nu = 85.7 \text{Hz} + 3.12 (1 \text{H}, \text{s}), 1.75 (2 \text{H}, \text{m}), 1.44 (3 \text{H}, \text{s}) + 1.41$ (3H,s), 0.97(3H,m)

【0398】<参考例5>

3-(2,6-ジフルオロベンジルスルホニル)-5-エチルー5ーメチルー2ーイソオキサゾリンの製造 3 - (2.6 - ジフルオロベンジルスルフィニル) - 5ーエチルー5-メチルー2-イソオキサゾリン()、88 (2.8ミリモル)のクロロホルム50m1溶液に、氷 冷下、m-クロロ過安息香酸1.0g(純度70%、4、 1ミリモル)を加え1時間概控した。その後、さらに室 温で12時間摂拌した。反応終了後、反応溶液を水中に 注ぎクロロホルムで抽出した。得られた有機層を亜硫酸 水素ナトリウム水溶液、炭酸カリウム水溶液、水及び食 た。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲルカラムクロ マトグラフィー(展開密媒:ヘキサンー酢酸エチル混合 溶媒) で精製し、白色粉末 (融点64~65℃) の3-(2,6-ジフルオロベンジルスルホニル) -5-エチ ルー5ーメチルー2ーイソオキサゾリン0.6g(収率 75.0%) を得た。

 1 H-NMR值(CDC1,/TMS δ (ppm)):7.36-7.46(1H. m). 6.98-7.04(2H,m). 4.73(2H,s), 3.04(2H,ABq, 3=17, $2, \Delta \nu = 51.1 \text{Hz}$). 1.77(2 H,q), 1.46(3 H,s), 0.97(3 H,t)【0399】<参考例6>

キサゾリンの製造 3-クロロー5、5-ジメチルー2-イソオキサゾリン 143.0g(1.07モル)のN, N-ジメチルホルム アミド500m1溶液に、氷冷下、メチルメルカプタン ナトリウム水溶液1.0kg (含量15%, 2.14モ ル)を適下し、その後室温で12時間搬拌した。反応終 了後、反応恣波を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得 られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシ 10 ウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、5.5-ジメチ ル-3-メチルチオ-2-イソオキサゾリンを115. 0g(収率74.1%)得た。この抽出物(741.2ミ リモル)をクロロホルム11に溶解し、氷冷下、m-ク ロロ過安息香酸392.0g(純度70%. 1.59モ ル)を加え1時間撹拌した。その後、さらに室温で12 時間搬搾した。反応終了後、析出したm-クロロ安息香 酸を濾別し、濾液を亜硫酸水素ナトリウム水溶液、水、 炭酸水素ナトリウム水溶液及び食塩水で順次洗浄した 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留

(1H-NMR値(CDC),/TMS &(ppm)):3.26(3H,s). 3.12 (2H.s), 1.51(6H.s)

末(融点82~84℃)の5,5-ジメチル-3-メチ

ルスルホニル-2-イソオキサゾリン?7.6g(収率

<参考例7>

59、1%)を得た。

5,5-ジメチルー3-エチルチオー2-イソオキサゾ リンの製造

3-クロロー5、5-ジメチル-2-イソオキサゾリン 30 を含有した反応溶液に、エチルメルカプタン560.0 g(9.0モル)および水酸化ナトリウム360.0g(9. ()モル)の水溶液 15 () (m ! を加えた。その後、6 () ~70℃で16時間擬粋した。反応終了確認後,反応恣 液を水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を 水および食塩水で洗浄した後、魚水硫酸マグネシウムで 乾燥した。減圧下溶媒を留去し、濃赤色油状の5,5-ジメチルー3-エチルチオー2-イソオキサゾリンの粗 化合物270.0 g得た。

【0400】<参考例8>

塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、40~5、5-ジメチル-3-エチルスルホニル-2-イソオ キサゾリンの製造

> 5,5-ジメチルー3-エチルチオー2-イソオキサゾ リンの租油状物270.0g(1.7モル)をクロロホルム 1.0 ! に溶解し、氷冷下、m-クロロ過安息香酸10 50g(純度70%, 6.1モル)を加え1時間銀枠 し、その後、さらに窒温で12時間攪拌した。反応終了 確認後、析出したm-クロロ安息香酸を適則し、總液を 亜鞣酸水素ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶 液、水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシ 50 ウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキ

(173)

特闘2002-308857

344

サンで洗浄し、白色粉末の5,5-ジメチル-3-エチ ルスルホニル-2-イソオキサゾリン133.6g(収 率65.4%)を得た。

【0401】<参考例9>

1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1月-ビラゾ ールー5ーオールの製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル34.1g(18 4.9ミリモル)のエタノール500ml溶液にフェニル ヒドラジン208(184.9ミリモル)及び遊塩酸4m !を加えた後、1時間加熱遺瘡した。反応終了後、減圧 10 (10.9ミリモル)のジエチルエーテル60m | 溶液を 下溶媒を大部分留去し、残渣に水を加えて結晶を折出さ せた。ろ過し、得られた結晶をろ液が中性になるまで水 で洗浄した後、乾燥して、黄土色結晶の1-フェニルー 3-トリフルオロメチル-1月-ピラゾール-5-オー ル37.1g(収率87.9%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TNG &(ppm)): 7.68-7.41(5H, m), 5.86(1H, s), 3.71(1H,s)

【0402】<参考例10>

5-クロロー1-フェニル-3-トリブルオロメチルー 1 H‐ピラゾール‐4 ‐カルボアルデヒドの製造 N,N-ジメチルホルムアミド?,7g(105.2ミリモ ル)に、氷冷下、オキシ塩化リン33.6g(219.1ミ リモル)を加えた。次に、室温で1-フェニルー3-ト リフルオロスチルー1日-ピラゾールー5-オール20 g(87.7ミリモル)を加えた後、1時間舶熱還流し た。反応終了後、氷冷下、反応溶液を水中に注ぎクロロ ホルムで抽出した。得られた有機層を炭酸水素ナトリウ ム水溶液及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネ シウムで乾燥した。減圧下溶媒を習去し、残渣をシリカ ゲルカラムクロマトグラフィー(展開密線: ヘキサン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、白色結晶の5-クロロ -1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラ ゾールー4ーカルボアルデヒド19.1g(収率79.1 %)を得た。

(1H-NAR (CDC), /TNG 8 (ppm)): 10.06(1H, s), 7. 57(5H, s)

【0403】<参考例11>

(5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールー4 - イル) - メタノールの製造 水素化リチウムアルミニウム 0.2 1 g (5.6 ミリモル) 40 ルー1H-ピラゾールー4 -イル)-メタノールの製造 のTHF 7 0 m 1 溶液を - 3 0 ℃に冷却し、5 - クロロ -1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1H-ピラ ゾールー4ーカルボアルデヒド3g(10.9ミリモル) のテトラヒドロフラン30m | 溶液を徐々に加えた。さ ちに-30℃で30分間捌拌した。反応終了後、酢酸エ チルを加えて捌拌した後、水を加え、しばらく捌拌し た。この反応混合物を減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチルで 抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水 硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、白

ロメチルー 1 H‐ピラゾールー 4 ‐イル)‐メタノール 3.0g(収率99,9%)を得た。 (1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 7.54-7.51(5H, m), 4.71(2H, d), 1.79(1H, b) 【0404】<参考例12> 4-プロモメチルー5-クロロー1-フェニルー3-ト リフルオロメチル-1日-ビラゾールの製造 (5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメチル - 1 H-ピラゾールー4-イル)-メタノール3.0g - 1 0 ℃に冷却し、三奥化リン 1 .0 g (3 .8 ミリモル) を加え、さらに室温で1時間機控した。反応終了後、反 応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有 機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾 燥した。減圧下溶媒を留去し、白色結晶の4-プロモメ チルー5-クロロー1-フェニルー3-トリフルオロメ チルー1月-ビラゾール3.6g(収率95.8%)を得

(1H-NAR値(CDC)。/TMS &(ppm)): 7.58-7.48(SH. 20 m), 4.48(2H, s)

【0405】<参考例13>

5-フルオロー1-フェニルー3-トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールー 4 - カルボアルデヒドの製造 5-クロロー1-フェニルー3ートリフルオロメチルー 1H‐ピラゾール‐4‐カルボアルデヒド33、0g(1 20.1ミリモル)のジメチルスルホキシド500m1溶 液に、ふっ化カリウム10、5g(180、2ミリモル)を 加え、100°Cで2時間捌拌した。反応終了後、反応終 液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層 30 を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し た。海圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲルカラムクロ マトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合 |恣媒||で錯製し、5-ブルオロ-1-フェニル-3-ト| リフルオロメチルー 1 日 - ピラゾール - 4 - カルボアル デヒド26.5g(収率85.0%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TAG &(ppm)): 9.96(1H, s), 7.6 8-7.51(5H, m)

【0406】<参考例14>

(5-フルオロー1-フェニルー3-トリフルオロメチ 水素化ホウ素ナトリウム1,6g(41.0ミリモル)の メタノール300ml溶液に、氷冷下、5~フルオロー 1-フェニル-3-トリフルオロメチル-1月-ビラゾ ール-4-カルボアルデヒド26.5g(102.5ミリ モル)のメタノール200ml溶液を加え、0°Cで30 分間概律した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸 エチルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図 去し、(5-フルオロー1-フェニル-3-トリフルオ 色結晶の(5 -クロロ-1 -フェニル-3 -トリフルオ 50 ロメチル-1 H-ピラゾール-4 -イル)-メタノール

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

2/16/2005

(174)

特闘2002-308857

345

28,5g(収率100%)を得た。

(1H-NAR値(CDC):/TNG &(ppm)): 7.65-7.41(5H, n), 4.68(2H, d), 1.73(1H, τ)

345

【0407】<参考例15> 4 - ブロモメチルー5 -フルオロー1 - フェニルー3 -トリフルオロメチルー1H-ピラゾールの製造 (5-フルオロー1-フェニルー3-トリフルオロメチ ルー1月-ピラゾールー4-イル)-メタノール27.5 g(105.7ミリモル)のジエチルエーテル300m1 溶液を0℃に冷却し、三臭化りん10.0g(37.0ミ リモル)を加え、さらに室温で2時間機拌した。反応終 了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽出し た。得られた有機圏を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マ グネシウムで乾燥した。 凝圧下溶媒を留去し、4-プロ モメチルー5-フルオロー1-フェニルー3ートリフル オロメチルー1 Hーピラゾール30,3g(収率88.8 %)を得た。

 $\{^1$ H-NHR値(CDC)。/TMS δ (ppm));7.66-7.42(SH, m), 4.44(2H. s)

【0408】<参考例16>

1-tert-ブチルー3-トリフルオロメチルー1H-ビ ラゾールー5-オールの製造

トリフルオロアセト酢酸エチルエステル552.3 g (3.0モル)のエタノール1500m!溶液にtertーブ チルヒドラジン塩酸塩373.8g(3,0モル)及び濃塩 跛50m!を加えた後、2日間加熱遠流した。反応終了 後、減圧下溶媒を大部分留去し、残渣を水中に注ぎ酢酸 エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順 次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧 下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキサンで洗浄し、白色粉 30 マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、4-ブ 末の1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1月 ーピラゾールー5ーオール369.0g(収率59.1%) を得た。

【0409】<参考例17>

1-tert-ブチルー5-クロロー3-トリフルオロメチ ルー1日・ピラゾールー4-カルボアルデヒドの製造 N.N-ジメチルホルムアミド87.7g(1.2モル) に、氷冷下、オキシ塩化リン462、0g(3.0モル)を 加えた。次に、室温で1-tert-ブチル-3-トリフル オロメチルー1 Hーピラゾールー5-オール208.2 g(1.0 モル)を加えた後、10時間加熱還流した。反 応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで抽出し た。得られた有機圏を水、5%水酸化ナトリウム水溶液 及び水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥 した。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲルカラムク ロマトグラフィー(展開密媒:ヘキサン-酢酸エチル混 合溶媒)で舗製し、白色結晶の1-tert-ブチルー5-クロロー3-トリフルオロメチル-1H-ピラゾールー 4-カルボアルデヒド131.5g (収率21.7%) を 得た。

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 9.97(1H, d), 1.7 6(9H, s)

【0410】<参考例18>

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメ チルー1月-ピラゾール-4-イル)-メタノールの製

1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメチ ルー1日-ピラゾールー4-カルボアルデヒド39.9 g(156,9ミリモル)のメタノール300m l 溶液を 10 0 ℃に冷却し、水素化ホウ素ナトリウム 8.5 g(17 2.6ミリモル)を徐々に加え、さらに室温で3時間撹拌 した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで 抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水 硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、 (1 - tert - ブチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメ チルー1日-ビラゾール-4-イル)-メタノール37、 7g (収率93.6%) を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 4.60(2H, d), 1.7 2(9H, s), 1.58(1H, t)

20 【0411】<参考例19>

4-プロモメチルー1-tert-ブチル-5-クロロー3 - トリフルオロメチルー L H - ピラゾールの製造 (1 - tert - プチル - 5 - クロロ - 3 - トリフルオロメ チルー1日-ビラゾール-4-イル)-メタノール9、2 g(35,7ミリモル)のジエチルエーテル100m1溶 液を−10℃に冷却し、三臭化リン11.6g(42.9) ミリモル)を加え、さらに室温で一夜機拌した。反応終 了後、反応溶液を氷水中に注ぎジエチルエーテルで拍出 した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸 ロモメチルー1-tert-ブチルー5-クロロー3-トリ フルオロメチルー1月-ピラゾール10.0g(収率8 7.3%)を得た。

【0412】<参考例20>

(1-tert-ブチル-5-クロロ-3-トリフルオロメ チルー1月-ビラゾール-4-イル)-メタンチオール の製造

水硫化ナトリウム水和物21.8g(純度70%, 27 2.2 ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミド300 ml溶液に4-プロモメチル-l-tert-ブチル-5-クロロー3ートリフルオロメチルー1Hーピラゾール4 3.5g(136.1ミリモル)を加え、さらに室温で一夜 幾拌した。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎジェチ ルエーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄 した後、無水臓酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒 を留去し、(1 - tert-ブチル-5-クロロ-3-トリ フルオロメチルー1目-ピラゾールー4-イル)-メタ ンチオール32.3g(収率87.0%)を得た。

('H-NNR値(CDC),/TMS S(ppm)): 3.65(2H, d), 1.9 50 0(1H, t), 1.70(9H, s)

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

(175)

特闘2002-308857

348

【0413】<参考例21> 1-tert-ブチル-5-メトキシ-3-トリフルオロメ

347

チル・1日・ピラゾールの製造 1-tert-ブチル-3-トリフルオロメチル-1H-ビ ラゾールー5-オール18,8g(90.3ミリモル)の N、N-ジメチルホルムアミド100m!溶液に、室温 で無水炭酸カリウム15,0g(108,4ミリモル)及 びヨウ化メチル19.3g(135.5ミリモル)を加 え、さらに15時間機拌した。反応終了後、反応溶液を 水中に注ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機 10 層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシ ウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、1-tert-ブチ ルーちーメトキシー3ートリフルオロメチルー1Hーピ ラゾール20.0g(収率99.8%)を得た。

【0414】<参考例22>

!- tert-ブチルー4 - クロロメチル-5 - メトキシー 3-トリフルオロメチルー1目-ピラゾールの製造 1 - tert- ブチル-5 - メトキシ-3 - トリフルオロメ チルー1目-ピラゾール2(),()g(9(),1ミリモル)の ルムアルデヒド換算180、2ミリモル)及び濃塩酸20 m1を加え60℃で30分間加熱線針した。反応終了 後、反応溶液を水中に注ぎジイソプロビルエーテルで抽 出した。得られた有機層を水で洗浄した後、無水硫酸マ グネシウムで乾燥した。滅圧下溶媒を留去し、1 - tert ープチルー4ークロロメチルー5ーメトキシー3ートリ フルオロメチルー1月-ビラゾール21.7g(収率8 9.0%) を得た。

【()415】<参考例23>

1 H - ピラゾールの製造

3-ヒドロキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチル -1H-ピラゾール10.0g(60.2ミリモル)の N、N-ジメチルホルムアミド50m1溶液に、室温で **魚水炭酸カリウム10.0g(72.3ミリモル)及びヨ** ウ化メチル12,8g(90.3ミリモル)を加え、さら に15時間鐡紗した。反応終了後、反応総液を水中に注 ぎジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を水及 び食塩水で腐次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾 燥した。減圧下溶媒を図去し、3-メトキシー1-メチ 46 リフルオロメチルー1H-ビラゾールの製造 ルー5ートリフルオロメチルー1日-ピラゾール9.8 g(収率90.7%)を得た。

【0416】<参考例24>

4-クロロメチルー3-メトキシー1-メチルー5-ト リフルオロメチルー1月-ビラゾールの製造

3-メトキシー1-メチル-5-トリフルオロメチルー 1 H-ピラゾール1 .00g(5.6ミリモル)の酢酸25 m 1 溶液に、パラホルムアルデヒド 0,45 g (ホルムア ルデヒド換算15.0ミリモル)及び渡塩酸5m1を加え 8.0 ℃で2時間加熱機拌した。反応終了後、反応溶液を 50 フルオロメチルー1 Hービラゾール3.1.4 g (収率8

水中に注ぎ炭酸カリウムを用いて中和した後、酢酸エチ ルで抽出した。得られた有機層を水洗浄した後、無水硫 酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣 をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:へ キサンー酢酸エチル混合溶媒)で錯製し4-クロロメチ ルー3-メトキシー1-メチルー5-トリフルオロメチ ルー1月-ピラゾール()、83g(収率65,0%)を得

【0417】〈参考例25〉

5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチルー 1日-ピラゾールー4-カルボアルデヒドの製造 5-クロロー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1 H-ピラゾール-4-カルボアルデヒド60.4g(28 2.7ミリモル)のジメチルスルホキンド700m1溶液 に、ふっ化カリウム42,0g(711,9ミリモル)を加 え、120~140℃で5時間機拌した。反応終了確認 後、反応溶液を水に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られ た有機層を水および食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグ ネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリ 酢酸90m!溶液に、パラホルムアルデヒド5 ,4g(ホー20) カゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン - 酢酸エチル混合溶媒)で精製し、5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾール**-**4-36.8g(収率66.0%)を得た。

【()418】<参考例26>

(5-フルオロー1-メチルー3-トリフルオロメチル - 1 H - ピラゾールー4 - イル) - メタノールの製造 水素化ホウ素ナトリウム3.9g(102.6ミリモル) のメタノール500m1に溶液、氷冷下、5-ブルオロ - 1 - メチル - 3 - トリフルオロメチル - 1 日 - ピラゾ 3-メトキシ-1-メチル-5-トリフルオロメチルー 30 ール-4-カルボアルデヒド36.8g(187.6ミリ モル)のメタノール200m ! 溶液を加えた。0℃で3 0 分間機拌した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ 酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩 水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減 圧下溶媒を図去し、(5-フルオロー1-メチル-3-トリフルオロメチルー1H-ピラゾールー4ーイル)-メタノール35,4g (収率95,4%) を得た。

【0419】<参考例27>

4 - プロモメチルー5 - フルオロー 1 - メチルー3 - ト 5-フルオロー1-メチル-3-トリフルオロメチルー 1 H-ピラゾールー4ーカルボアルデヒド35、4g(1 78.7ミリモル)のジエチルエーテル500m1溶液を -30℃に冷却し、三臭化りん54,0g(199.5ミ リモル)を加えた。室温で12時間攪拌した。反応終了 確認後、反応溶液を水に注ぎジェチルエーテルで抽出し た。得られた有機層を水及び食塩水で洗浄した後、無水 硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4 ープロモメチルー5ーフルオロー1ーメチルー3ートリ (176)

特闘2002-308857

350

(),8%)を得た。

【0420】<参考例28>

(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒドの製造 水素化ナトリウム12.6g(純度60%、525.0ミ リモル)をジエテルエーテルで数回デカントした後、ジ エチルエーテル500m1溶液とした。そして、窒素気 施下、0~10℃で、ギ酸エチル194g(2.6モル) および3、3~ジェトキシープロピオン酸エチルエステ ル50g(262.0ミリモル)を加えた。その後、妄温 で15時間緩斜し、反応終了確認後。反応溶液を水に注 10 フィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精 ぎ、ジエチルエーテルで洗浄した。得られた水層を塩酸 でpH1とした後、ジクロロメタンで抽出した。更に、 得られた有機層を食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、緩赤色抽状の(エ トキシカルボニル)マロンジアルデヒドの組化合物37、 68(収率100%)を得た。

349

6(1H,s),4.27(2H,q),1.28(3H,t)

【()421】<参考例29>

(エトキシカルボニル)マロンジアルデヒド27.6 g(1 92ミリモル)のエタノール150m!溶液に氷冷下。 ヒドラジン6,2g(193ミリモル)を加え、窒温で1 7時間擬拌した。その後、減圧下エタノールを留去し、 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶 模:ジクロロメタン-酢酸エチル混合溶媒)で精製し、 黄色結晶の1H‐ピラゾール‐4‐カルボン酸エチルエ ステル19,4g(72,4%)を得た

(1H.s).4.31(2H, q).1.36(3H.t)

【0422】<参考例30>

1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチル エステルの製造

1H-ピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル1. 5g(10.7ミリモル)のN, N-ジメチルホルムアミ ド50m!溶液に無水炭酸カリウム3.7g(26.8) リモル)、ヨウ化エテル4.2g(26.6ミリモル)を加 え、室温で20時間機拌した。反応終了確認後、反応終 液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層 40 ン1、3g(4、8ミリモル)を加え、更に窒温で12時間 を水および食塩水で洗浄後、魚水硫酸マグネシウムで乾 燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラム クロマトグラフィー(展開密媒: ヘキサン-酢酸エチル 混合溶媒)で精製し、黄色油状物の1-エチル-1H-ピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル1,6g(収 率88.9%)を得た。

(1H-NMR値(CDC),/TMS &(ppm)): 7.90(2H, 5),4.28 (2H,q),4.18(2H, q),1.51(3H,t),1.35(3H,τ) 【0423】<参考例31>

- カルボン酸エチルエステルの製造

1-エチル-1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチル エステル1.6g(9.5ミリモル), N-クロロとはく酸 イミド 5、1g(38、3ミリモル)をガラス封管に入 れ、160℃で6時間反応させた。反応終了後、室温ま で冷却し、反応物を四塩化炭素およびクロロホルムで洗 浄、返圧ろ過した。得られたろ液(有機圏)を水および食 塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧 下溶媒を図去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ 製し、黄色油状物の3.5-ジクロロー1-エチルー1 目-ビラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.() g (収率44.2%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 4.36(2H,q),4.21 (2H, q), 1.44(3H, t), 1.38(3H, t)

【0424】<参考例32>

(3,5-ジクロロー1-エチルー1H-ピラゾールー4 ーイル)メタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム(0.16g(4.2ミリモル) 1H-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステルの製 20 のテトラヒドロフラン70ml溶液を-50℃に冷却 し、3,5-ジクロロー1-エチルー1日-ピラゾール -4-カルボン酸エチルエステル1.0g(4.2ミリモ ル)のテトラヒドロフラン30m1溶液をゆっくり滴下 し、更に-50℃で3時間搬拌した。反応終了確認後、 酢酸エチルを加えて、しばらく微拌した後、更に水を加 え、しばらく摂拌した。減圧ろ過し、ろ液を酢酸エチル で抽出した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図 去し、茶色油状物の(3,5-ジクロロ-1-エチル-1 100%)を得た。

> ('H-NNR値 (CDC)」/TMG &(ppm)); 4.52(2H,s), 4.1 6(2H,q), 1.43(3H,t)

【0425】<参考例33>。

4-プロモメチルー3,5-ジクロロー1-エチルー1 H-ピラゾールの製造

(3.5-ジクロロー1-エチルー1H-ピラゾールー4 ーイル)メタノール()、82g(4,2ミリモル)のジエチ ルエーテル50m!溶液を-30℃に冷却し、三臭化リ 縦绊した。反応終了確認後,反応溶液を水に注ぎ、酢酸 エチルで抽出した。得られた有機圏を水および食塩水で 洗浄後、無水磁酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒 を留去し、黄色油状物の4-プロモメチルー3,5-ジ クロロー1-エチルー1H-ピラゾール().9 g (収率8 1,8%)を得た。

 $\{^1_{H-NMR}$ 館 $\{CDC1_{L}/TMS \ \delta(ppm)\}: 4.33(2H,s), 4.13$ $(2H,q), 1.43(3H,\tau)$

【0426】<参考例34>

3,5ージクロロー1-エチルー1目-ピラゾールー4 50 3ージフルオロメチルー1-メチルー1目-ピラゾール

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

(177)

特闘2002-308857

- 5 - オールの製造

ジフルオロアセト酢酸エチルエステル30.0g(18 0.6ミリモル)のエタノール200ml溶液にメチルヒ ドラジン8.3g(180.6ミリモル)及び濃塩酸5m! を加えた後、2日間加熱還流した。反応終了後、減圧下 密媒を大部分留去した。残渣を水中に注ぎクエン酸でp H4とした後、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層 を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、残渣をシリカゲル カラムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサンー酢酸 10 ピラゾール2.8g(収率100.0%)を得た。 エチル混合溶媒)で錆製し、3-ジフルオロメチルー1 ーメチルー1H-ピラゾールー5-オール8,9g(収率 33.3%)を得た。

351

【0427】<参考例35>

5-クロロー3-ジフルオロメチル-1-メチル-1日 - ビラゾール - 4 - カルボアルデヒドの製造

N. Nージメチルホルムアミド7.9g(108.0ミリ モル)に、氷冷下、オキシ塩化リン41.6g(270.1 ミリモル)を加えた。次に、室温で3-ジブルオロメチ ルー1ーメチルー1員-ビラゾール-5-オール8.0 g(5.4.0 ミリモル)を加えた後、4時間加熱還癒し た。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎクロロホルムで 抽出した。得られた有機層を水、5%水酸化ナトリウム 水溶液及び水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム で乾燥した。返圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカ ラムクロマトグラフィー(展閲溶媒:ヘキサン-酢酸エ チル混合溶媒)で精製し、白色結晶の5-クロロー3-ジフルオロメタルー1ーメタルー1H-ピラゾールー4 ーカルボアルデヒド7.7g(収率73.3%)を得た。 (1H-NAR値(CDC),/TMG &(ppm)):9.96(1H.s), 6.90 (1H,t,3=53.6Hz), 3.93(3H,s)

【0428】<参考例36>

(5-クロロー3-ジフルオロメチル-1-メチル-1 員-ピラゾール-4 -イル)-メタノールの製造 5-クロロー3-ジフルオロメチルー1-メチルー1日 ーピラゾールー4ーカルボアルデヒド7.28(37.0) ミリモル)のメタノール100m1溶液を0℃に冷却 し、水素化ポウ素ナトリウム2,1g(55,5ミリモル) を徐々に加え、さらに室温で3時間搬拌した。反応終了 れた有級層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、(5-クロロー3) ージフルオロメチルー1ーメチルー1H-ピラゾールー 4-イル)-メタノール3.8g(収率52.1%)を得 た。

(1H-MAR6値(CDC):/TMS &(ppm)):6.70(1H, t, J=40.8H z), 4.63(2H,s), 3.86(3H,s), 1.79(1H,br) 【0429】<参考例37> 4-プロモメチルー5-クロロー3-ジフルオロメチル - 1 - メチル - 1目 - ピラゾールの製造

(5-)ロロー3-ジブルオロメチルー1-メチルー1 $H - U \ni V - N - 4 - 4N) - x x y - n 2 .0 x (10).$ ()ミリモル)のジエチルエーテル50ml溶液を-10 ℃に冷却し、三臭化リン1.0g(3.5ミリモル)を加 え、さらに室温で一夜攪拌した。反応終了後、反応溶液 を氷水中に注ぎジェチルエーテルで抽出した。得られた **有機層を食塩水で洗浄した後、魚水硫酸マグネシウムで** 乾燥した。減圧下溶媒を留去し、4-プロモメチル-5 ークロロー3 - ジフルオロメチルー1 - メチルー1日-

【0430】<参考例38>

トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテレートの

トリフルオロアセトアルデヒドへミエチルアセタールち 0.0g(347.0ミリモル)のメタノール80m1窓 液に、ヒドロキシルアミン塩酸塩24,1g(347,0 ミリモル〉、水160mlを加え、氷冷下、50%水酸 化ナトリウム水溶液80.0g(1.7モル)を滴下し た。滴下終了後室温で6時間鏡拌した。反応終了後、1 20 0%塩酸を加えてpHBとし、ジエチルエーテルで抽出 した。減圧下溶媒を図去し、残渣を蒸留し、トリフルオ ロアセトアルデヒドオキシムエーテレート24、7g (収率38.0%)を得た。

【0431】<参考例39>

トリフルオロアセトヒドロキシモイルプロミドエーテレ ートの製造

トリフルオロアセトアルデヒドオキシムエーテレート2 4.7 g (131.7 ミリモル) のN,N-ジメチルホル ムアミド50ml溶液に、氷冷下、N-プロモとはく酸 30 イミド38.8g (218.0ミリモル) のN,N-ジメチ ルホルムアミド125ml溶液を加え、室温で3時間機 控した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエ ーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図 去し、残渣を蒸留し、褐色油状物質のトリフルオロアセ トヒドロキシモイルプロミドエーテレート33.3g (収率95.0%)を得た。

【0432】<参考例40>

後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得ち 40 4-エトキシカルボニル-5-メチル-3-トリフルオ ロメタルイソキサゾールの製造 アセト酢酸エチル6.7g(51.3ミリモル)のメタノ ール80m!溶液に、ナトリウムメトキシド2.8g (51.3ミリモル)を加え、氷冷下、トリフルオロア セトヒドロキシモイルブロミドエーテレート5.0g (18.8ミリモル)のメタノール20ml溶液を加え た。室温で3時間撹拌した。反応終了後、減圧下溶媒を 図去し、水を加え、クロロホルムで抽出した。得られた 有機層を食塩水で洗浄した後、無水確酸マグネシウムで 50 乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラ

特別2002-308857

354

ムクロマトグラフィー(展開溶媒:ヘキサン-酢酸エチ ル混合溶媒)で精製し、無色油状物質の4-エトキシカ ルポニルー5-メチルー3-トリフルオロメチルイソキ サゾール2.9g(収率69.0%)を得た。

353

(1H-NMR値(CDC),/TNS &(ppm)): 4.36(2H, q), 2.7 7(3H, s), 1.37(3H, t)

【①433】<参考例41>

(5-メチルー3-トリフルオロメチルイソキサゾール -4-イル)-メタノールの製造

のTHF 15 m 1 溶液をり ℃に冷却し、4-エトキシカ ルボニルー5-メチルー3-トリフルオロメチルイソキ サゾールO.93 g(4.2 ミリモル)のTHF 15 m ! 溶 液を徐々に加えた。()℃で1時間繊維した。反応終了 後、酢酸エチルを加えてしばらく躁拌した後、水を加 え、しばらく攪拌した。源圧ろ過し、ろ液をジエチルエ ーテルで抽出した。得られた有機圏を食塩水で洗浄した 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図 去し、(5-メチルー3-トリフルオロメチルイソキサ ゾールー4 - イル) - メタノール () .5 g (収率60 .0) %) を得た。

(1H-NAR値(CDC1,/TNG お(ppm)): 4.60(2H, d), 2.5 4(3H, s), 1.66(1H, br)

【()434】<参考例42>

4-プロモメチルー5-メチルー3-トリフルオロメチ ルイソキザゾールの製造

(5-メチルー3-トリフルオロメチルイソキサゾール -4-イル)-メタノール().45g(2.5ミリモル)の ジエチルエーテル10m1溶液を0°Cに冷却し、三臭化 りん0.2g(8.9ミリモル)を加えた。 室温で1時間鏝 30 控した。反応終了後、反応溶液を水中に注ぎジエチルエ ーテルで抽出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した 後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図 去し、4-プロモメチル-5-メチル-3-トリフルオ ロメチルイソキサゾール0.5g(収率74.0%)を得

(1H-NAIR値(CDC)。/TMS &(ppm)): 4.31(2H, d), 2.5 1(3H, s)

【0435】<参考例43>

ーメタノールの製造

水素化リチウムアルミニウム(0.42g(11.0ミリモ ル)のテTHF 1 0 m 1 溶液に、 - 3 0 ℃で 5 - クロロ -3-メチル-イソチアゾール-4-カルボン酸エチル エステル2.06g(10.0ミリモル)のTHF10m! **恣液を満下し、さらに同温度で1時間捌拌した。反応終** 了確認後、反応溶液に酢酸エチルを加えた後、水中にあ け酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩 水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥し

マトグラフィーで精製し、(5-クロロー3-メチルー イソチアゾールー4ーイル)ーメタノール1.50g(収 率91.5%)を得た。

【0436】<参考例44>

4-クロロメチルー5-クロロー3-メチルイソチアゾ ールの製造

(5-クロロー3-メチルーイソチアゾールー4-イル) ーメタノール1.50g (9.15ミリモル)のクロロホ ルム10m!溶液に、窒温で塩化チオニル3.26g(2 水素化リチウムアルミニウム(), 1.6 g(4...2 ミリモル) 10 7..4 4 ミリモル)を加え3時間機拌した。反応終了確認 後、減圧下溶媒を図去し、4-クロロメチル-5-クロ ロー3-メチルインチアゾール1.67g(収率定置 的) を得た。

【0437】<参考例45>

4-トリフルオロメチルニコチン酸メチルエステルの製 造

4-トリフルオロメチルニコチン酸 4.6 g(24.1 ミ リモル)のN、Nージメチルホルムアミド70m!溶液 に、無水炭酸カリウム6.7g(48,6ミリモル)、ヨウ 20 化メチル6.9g(48.6ミリモル)を加え、室温で12 時間概控した。反応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、 酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水および食塩 水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下 恣媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフ ィー(展開溶媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製 し、黄色油状物の4-トリフルオロメチルニコチン酸メ チルエステル2,77g(収率56.1%)を得た。

(1H-NAR値(CDC),/TMS &(ppm)): 9.11(1H,s),8.92 (1H,d), 7.64(1H,d), 3.99(3H,s)

【①438】<参考例46>

(4~トリフルオロメチルピリジン~3~イル)~メタノ ールの製造

水素化リチウムアルミニウム().37g(9.7ミリモル) のTHF100m!溶液を-50℃に冷却し、4-トリ フルオロメチルニコチン酸メチルエステル2.0g(9. 8ミリモル)のTHF30m1溶液をゆっくり滴下し、 更に-50℃で3時間機拌した。反応終了確認後、酢酸 エチルを加えて、しばらく捌拌した後、更に水を加え、 再度しばらく攪拌した。反応混合物を減圧ろ過し、ろ液 (5 - クロロー 3 - メチルーイソチアゾールー4 - イル) 40 を酢酸エチルで抽出した。得られた有機圏を水および食 塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧 下溶媒を図去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ フィー(展開密媒: ヘキサンー酢酸エチル混合密媒)で精 製し、黄色油状物の(4-トリフルオロメチルビリジン -3-イル)メタノール().6g(収率35,3%)を得 た。

> (1 H-NHR値(CDC]₂/TNS δ (ppm)): 9.00(1H,s), 8.73 (1H,d), 7.51(1H,d), 4.95(2H,s) 【①439】<参考例47>

た。涿圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロ 50 3-ブロモメチル-4-トリフルオロメチルピリジンの

2/16/2005

http://www4.ipdl.ncipi.go.jp/tjcontentdben.ipdl?N0000=21&N0400=image/gif&N0401=/...

特開2002-308857

製造

(4~トリフルオロメチルピリジン-3-イル)メタノー ル (), 6 g (3,4 ミリモル)のジエチルエーテル5 (m) 1 溶液を-30℃に冷却し、三臭化リン1.4g(5.2 ミリモル)を加え、更に窒温で12時間鏝拌した。反応 終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出し た。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水硫 酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し 費色 袖状物の3-プロモメチル-4-トリフルオロメチルピ リジン(0.61g(収率75.3%)を得た。

355

(1H-NAR(値(CDC)) /TMS & (ppm)): 8.88(1H.s)、8.73 (1H,d), 7.54(1H,d), 4.63(2H,s)

【①440】<参考例48>

5-プロモー4-ヒドロキシー6-トリフルオロメチル ピリミジンの製造

4-ヒドロキシー6ートリフルオロメチルピリミジン4 9.2g(300,0ミリモル)の酢酸600m!溶液に、 室温で緑水酢酸ナトリウム?7.5g(945.0ミリモ ル)を加えた。さらに45°Cで反応溶液中に臭素50.3 した。反応終了確認後、源圧下溶媒を留去した。残渣を 水にあけ、酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を水 及び食塩水で順次洗浄した後、無水罐酸マグネシウムで 乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキサンで 洗浄し5ープロモー4ーヒドロキシー6ートリフルオロ メチルビリミジン38.9g(収率53.4%)を得た。

【0441】<参考例49>

5-プロモー4-クロロー6-トリフルオロメチルビリ ミジンの製造

ピリミジン24、38(100.0ミリモル)をオキシ塩化 リン18.5g(120.0ミリモル)に懸濁させ、100 ℃で2時間繊維した。反応終了確認後、反応溶液を徐々 に水にあけクロロホルムで抽出した。得られた有機層を 水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム で乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカ ラムクロマトグラフィーで舗製し、5-プロモ-4-ク ロロー6ートリフルオロメチルピリミジン21.5 g (収率82.4%)を得た。

【0442】<参考例50>

5-プロモー4-メトキシー6-トリフルオロメチルビ リミジンの製造

5-プロモー4-クロロー6-トリフルオロメチルピリ ミジン21.5g(82.2ミリモル)のメタノール100 m 1 溶液に、室温でナトリウムメトキンド16、7 m 1 (28%メタノール溶液 86.4ミリモル)を加え機律 した。反応終了確認後、減圧下溶媒を留去した。残渣を 水にあけ、クロロボルムで抽出した。得られた有機層を 水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム で乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をn-ヘキサン 50 %)を得た。

で洗浄し、5-プロモー4-メトキシー6-トリフルオ ロメチルビリミジン19.2%(収率91.0%)を得た。 【0443】<参考例51>

5-プロモー4-エトキシー6-トリフルオロメチルビ リミジンの製造

5-プロモー4-クロロー6-トリフルオロメチルビリ ミジン3,00g(11,48ミリモル)のエタノール50 m1溶液に、室温でナトリウムエトキシド().94g(1 3,77ミリモル)を加え搬針した。反応終了確認後、減 10 圧下溶媒を図去した。残渣を水にあけ、クロロホルムで 抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄し た後、魚水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を 図去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで 精製し5-プロモー4-エトキシー6-トリフルオロメ チルビリミジン2.44g(収率82.9%)を得た。

【0444】<参考例52>

4-メトキシー6ートリフルオロメチルビリミジンー5 - カルボアルデヒドの製造

5-プロモー4-メトキシー6-トリフルオロメチルビ g(315ミリモル)を徐々に加え、同温度で3時間擬拌 20 リミジン10.3g(40.0ミリモル)のテトラヒドロフ ラン100m1溶液に、-65~-60℃でn-ブチル リチウム30.0ml(1.6mol/l n-ヘキサン密 液48.0ミリモル)を徐々に加えた後、30分間攪拌し た。さらに同温度で、ギ酸エチル3.8 g(48.0ミリ モル)を加えた後、同温度で3時間攪拌した。反応溶液 を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得られた有機層を 水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシウム で乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカ ラムクロマトグラフィーで舗製し、4-メトキシー6-5-ブロモー4-ヒドロキシー6-トリフルオロメチル(30)トリフルオロメチルビリミジン-5-カルボアルデヒド 1.3 g (収率15.8%)を得た。

> 8(1H,s), 4.18(3H,s)

【0445】<参考例53>

4-エトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン-5 ーカルボアルデヒドの製造

5-プロモー4-エトキシー6-トリフルオロメチルビ リミジン5.76g(21.3ミリモル)のTHF250 m1溶液を-78℃に冷却し、n-ブチルリチム22. 6ml(1.6mol/! n-ヘキサン溶液 36,1 ミリモル)を滴下し、40分間機拌した。ギ酸メチル 2、7g(45.1ミリモル)を加え、さらに1、5時間 機拌した。反応終了後、塩化アンモニウム水溶液を加 え、ジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を食 塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネンウムで乾燥した。 減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマト グラフィー(展開窓媒:ヘキサンー酢酸エチル混合窓媒) で錯誤し、4-エトキシー6-トリフルオロメチルビリ ミジン-5-カルボアルデヒド3.82g(収率81.6

特闘2002-308857

(180)

(1H-NAR値(CDC),/TMG &(ppm)): 19.41(1H, s), 8. 95(1H, s), 4.63(2H, q), 1.48(3H, t) 【()446】<参考例54>

(4-メトキシー6-トリフルオロメチルビリミジン-5-イル)-メタノールの製造

4-メトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン-5 -カルボアルデヒド1.3 g(6.3 ミリモル)のメタノー ル30m1溶液に、窒温で水素化ホウ素ナトリウム0. 24g(6,3ミリモル)を徐々に加え3時間捌拌した。 **られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫** 酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、残渣 をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製し、(4) ーメトキシー6ートリフルオロメチルビリミジンー5ー イル)-メタノール()、42g(収率32.1%)を得 た。

(1H-NAR値(CDC)。/TNG &(ppm)): 8.93(1H.s), 4.81 (2H,5), 4.13(3H,5), 2.26(1H,br)

【0447】<参考例56>

5-イル》-メタノールの製造

水素化ポウ素ナトリウム 1.7g(4.5.7ミリモル)の メタノール50m!溶液に、氷冷下、4-エトキシー6 ートリフルオロメチルビリミジン-5-カルボアルデヒ ド3.82g(17.2ミリモル)のメタノール50点! 溶液を加え、さらに0℃で1時間攪拌した。反応終了 後、反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得ら れた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫酸マグネシウ ムで乾燥した。返圧下溶媒を留去し、(4-エトキシー ノール3.77 は (収率97.8%) を得た。

 $(^1\text{H-NNR値}(CDC)_s/TNG ~ S(ppm)): 8.80(1H, s), 4.8$ 1(2H, s), 4.59(2H, q),2.28(1H, b), 1.48(3H, t) 【1)448】<参考例56>

5-クロロメチルー4-メトキシー6-トリフルオロメ チルビリミジンの製造

(4-メトキシー6-トリフルオロメチルビリミジン-5-イル)-メタノール().42 g(2.02 ミリモル)の クロロホルム10m!溶液に、窒温で塩化チオニル1. 19g(10,1ミリモル)を加え3時間機拌した。反応 終了確認後、凝圧下溶媒を留去し、5-クロロメチルー 4-メトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン(). 45g(収率:定置的)を得た。

【0449】<参考例57>

5-ブロモメチルー4-エトキシー6-トリフルオロメ チルビリミジンの製造

(4-エトキシー6ートリフルオロメチルピリミジンー 5 - 1 -ジエチルエーテル50m1溶液を0°Cに冷却し、三臭化

控した。生じた塩をメタノールで溶解し、さらに 1 時間 銀拌した。反応溶液を水中に注ぎジエチルエーテルで抽 出した。得られた有機層を食塩水で洗浄した後、無水硫 酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を図去し、5-プロモメチルー4ーエトキシー6ートリフルオロメチル ビリミジンの組化合物を得た。

(1H-NMR値(CDC), /TNG S(ppm)): 8.79(1H, s), 4.6 1(2H, q), 4.55(2H, s), 1.49(3H, t)【0450】<参考例58>

反応終了確認後、水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。得(10)4-メトキシ-6-トリフルオロメチルピリミジン-5 - カルボアルデヒトの製造

5-プロモー4-メトキシー6-トリフルオロメチルビ リミジン10、3g(40、0ミリモル)のテトラヒドロフ ラン100m1溶液に、-65~-60℃でn-ブチル リチウム(1.6mol/1 n-ヘキサン溶液)30.0 m1(48,0ミリモル)を徐々に加えた後、30分間搬 **拌した。さらに同温度で、丰酸エチル3.6g(48.0)** ミリモル)を加えた後、同温度で3時間機拌した。反応 溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出した。 得られた有機 (4-エトキシー6-トリフルオロメチルピリミジン- 20 層を水及び食塩水で順次洗浄した後、無水硫酸マグネシ ウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残渣をシリカゲ ルカラムクロマトグラフィーで精製し、4-メトキシー 6-トリフルオロメチルビリミジン-5-カルボアルデ ヒド1.3g(収率15.8%)を得た。

> (1H-NAR値(CDC],/TMS &(ppm)): 10.41(1H, q), 8. 98(1H, s), 4.18(3H, s)

【0451】<参考例59>

(2 - クロロー4 - メチルピリジン - 3 - イル)メタノー ルの製造

6 - トリフルオロメチルビリミジン-5 - イル) - メタ 30 水素化リチウムアルミニウム0.4g(10.0ミリモル) のテトラヒドロプラン30m!懸瀾液に、-85~-8 0℃でメチル 2-クロロー4-メチルニコチン酸1.9 g(10.0ミリモル)のTHF5.0m1溶液を徐々に加 えた後、30分間機拌した。さらに-20℃で、1時間 鏝拌した。反応溶液を水中に注ぎ酢酸エチルで抽出し た。得られた有機層を水及び食塩水で順次洗浄した後、 魚水硫酸マグネシウムで乾燥した。源圧下溶媒を留去 し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーで精製 し、(2-クロロー4-メチルビリジン-3-イル)メタ 40 ノール().6g(収率38.2%)を得た。

> ('H-NNR値(CDC),/TMS &(ppm)): 8.19(1H, d), 7.0 8(1H, d), 4.85(2H, s),2.49(3H, s)

【0452】<参考例60>

3-アセチル-4-クロロメチル-2、5-ジクロロチ オフェンの製造

3-アセチル-2,5-ジクロロチオフェン5.0g(3 2.4ミリモル)のクロロメチルメチルエーテル26ml (323,0ミリモル)溶液に、氷冷下10°Cでの四塩化 チタン(2mol/!ジクロロメタン溶液)33ml(6

りん2.0g(7.2ミリモル)を加えた。室温で1時間鍵 50 6.0ミリモル)を滴下した。その後室温で2時間撥拌し

た。反応終了後、反応溶液を氷水中に注ぎクロロホルム で抽出した。得られた有機層を重曹及び水、食塩水で順 次洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧 下溶媒を図去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ フィー(展開恣媒:ヘキサン/酢酸エチル=9/1)で精 製し、黄色結晶の3-アセチル-4-クロロメチルー 2,5-ジクロロチオフェン2,6g(収率39,7%) を得た。

359

(1H-NNR値(CDC), /TNS & (ppm)): 4.70 (2H, s), 2. 56 (3H,s), 2.54 (3H,s)2.39(3H, s)

【0453】<参考例61>

3-プロモー2-プロモメチルベンゾフランの製造 ミリモル)のモノクロロベンゼン30m1溶液に、N-ブ ロモコハク酸イミド2.7 g(15.3ミリモル)及びアゾ ビスイソブチロニトリル()、48(2、7ミリモル)を加え た後、80℃で30分間捌拌した。原料消失を確認した 後、反応溶液を室温にまで冷却した。不溶物を滤別し、 徳波を減圧下溶媒を留去した。残渣を水中に注ぎ酢酸エ 洗浄した後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下 ラン3.0g(収率79.0%)を得た。

【0454】<参考例62>

1 - ジフルオロメチルー 1 H - ピラゾールー4 - カルボ ン酸エチルエステルの製造

1 Hーピラゾールー4ーカルボン酸エチルエステル3. 08 (21.4ミリモル)のN,N-ジメチルホルムアミ ド100m ! 溶液に、無水炭酸カリウム6.0g(43) 5ミリモル)を加え、クロロジフルオロメタンを反応溶 液に吹き込み。130~140℃で3時間鏝拌した。反 応終了確認後、反応溶液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出 した。得られた有機層を水および食塩水で洗浄後、無水 硫酸マグネシウムで乾燥した。減圧下溶媒を留去し、残 猹をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開密媒: ヘキサンー酢酸エチル混合溶媒)で精製し、無色透明油 状物の1-ジフルオロメチル-1日-ピラゾール-4-カルボン酸エチルエステル1.67g(収率41,0%)を 得た。

(1H,s),7.20(1H, t),4.32(2H,q),1.37(3H, t)本発明の除草剤は、一般式 [I] で示されるイソオキサ ゾリン誘導体及これを有効成分としてなる。

【り455】本発明化合物を除草剤として使用するには 本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般 的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤または補助剤 等を配合して、紛削、水和削、乳削、フロアブル削、微 粒剤または粒剤等に製剤して使用することもできる。

【0456】製剤化に際して用いられる担体としては、 - 例えばタルク: ベントナイト、クレー: カオリン: 珪藻 - 50 - 粗紛砕した化合物(3-0006)20部を水69部に

土.ホワイトカーボン、バーミキュライト、炭酸カルシ ウム、消石灰、珪砂、硫安、尿素等の固体担体、イソブ ロビルアルコール、キシレン、シクロヘキザン、メチル ナフタレン等の液体担体等があげられる。

【0457】界面活性剤及び分散剤としては、例えばア ルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタンジ スルホン酸金属塩、アルコール硫酸エステル塩、アルキ ルアリールスルホン酸塩、リグエンスルホン酸塩、ポリ オキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレ 10 ンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソル ビタンモノアルキレート等があげられる。浦助剤として は、例えばカルボキシメチルセルロース、ボリエチレン グリコール、アラビアゴム等があげられる。使用に限し ては適当な濃度に希釈して散布するかまたは直接能用す

【0458】本発明の除草剤は茎薬散布、土壌餡用また は水面施用等により使用することができる。有効成分の 配合割合については必要に応じて適宜遺ばれるが、粉剤 または粒剤とする場合は(). () 1~1()%(重量)、好 チルで抽出した。得られた有機層を水及び食塩水で順次 20 ましくは0.05~5%(重量)の簡囲から適宜遵ぶの がよい。乳剤及び水和剤とする場合は1~50%(量 **置)、好ましくは5~30%(重置)の範囲から適宜選** ぶのがよい。また、フロアブル剤とする場合は1~40 %(重量)、好ましくは5~30%(重量)の範囲から 適宜選ぶのがよい。

> 【0459】本発明の除草剤の施用量は使用される化合 物の種類、対象維草、発生傾向、環境条件ならびに使用 する剤型等によってかわるが、粉剤及び粒剤のようにそ のまま使用する場合は、有効成分として1ヘクタール当 30 り1g~50kg、好ましくは10g~10kgの範囲 から適直選ぶのがよい。また、乳剤、水和剤及びフロア ブル剤とする場合のように液状で使用する場合は、(). 1~50,000ppm. 好ましくは10~10.00 ①ppmの範囲から適宜遵ぶのがよい。

【0460】また、本発明の化合物は必要に応じて殺虫 剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長調節剤、肥料等と混 用してもよい。

【1)461】次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具 体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率 (¹H-NAR館(CDCl₂/TNG δ(ppm)): 8.32(1H.s),8.04 40 は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能 である。以下の説明において「部」は重置部を意味す る.

> 【0462】(製剤例1) 水和剤 化合物(3-0006)の10部にポリオキシエチレン オクチルフェニルエーテルの(). 5部、β-ナフタレン スルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、 **珪藻土の20部、クレーの69部を混合粉砕し、水和剤** を得た。

【0463】 (製剤例2) フロアブル剤

(182)

特闘2002-308857

分散させ、ポリオキシエチレンスチレン化フェニルエー テル硫酸塩4部、エチレングリコール?部を加えるとと

もにシリコーンAF-118N (旭化成工業株式会社製) を製 剤に対し200ppm加え、高速緩拌機にて30分間泥 合した後、湿式粉砕機にて粉砕しフロアブル剤を得た。

【0464】(製剤例3) 乳剤

化合物(3-0006)の30部にキシレンとイソホロ ンの等量混合物60部、界面活性剤ポリオキシエチレン ソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキル アリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの 10 育成し、処理後21日目に表145の基準に従って除草 混合物の10部を加え、これらをよくかきまぜることに よって乳剤を得た。

【0465】(製剤例4) 粒剤

化合物(3-0006)の10部、タルクとベントナイ トを1:3の割合で混合した増置剤の80部、ホワイト カーボンの5部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビ タンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリー ルポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物 の5部に水10部を加え、よく線ってベースト状とした ものを直径0. 7mmのふるい穴から押し出して乾燥し 20 【0469】 た後に0.5~1mmの長さに切断し、粒剤を得た。

【り466】次に試験例をあげて本発明化合物の奏する 効果を説明する。

【り467】(試験例1) 水田土壌処理による除草効 果試験

100cm*プラスチックボットに水田土壌を充填し、 代掻後、タイヌビエ、コナギの徂子を繙種し、水深3 c mに湛水した。翌日、製剤例1に進じて調製した水和剤 を水で希釈し、水面適下した。施用量は、有効成分を、 1ヘクタール当り1000gとした。その後、温室内で 効果を調査した。結果を表148~表148に示す。

[0468]

【表145】

指数	指数 除草効果(生育抑制程度)及び発音
5	90%以上の抑制の除草油果、東容
4	?0%以上60%未満の除草効果、東告
3	50%以上70%未续の政卓効果、獲容
z	80%以上50%未費の餘息効果、薬害
1	10%以上30%未協の除草効果、厳智
0	0%以上10%未満の除蛀効果、薬害

【表146】





(183)

特闘2002-308857 364

363

化合物器号	聚量(ga.j./ha)	タイプピエ	コナキ・
1.0001	1000	5	5
1-0002	1000	8	5
1.0003	1000	5	5
1.0004	1080	5	ō
1-0005	1000	ō	5
2-0001	1000	5	5
2.0003	1000	6	5
2.0004	1000	5	5
2:0005	1000	5	5
2-0006	1000	5	5
2-0008	1000	5	5
2-8011	1000	5	5
2-0012	1000	ā	5
3 - 0002	1000	5	5
3.0004	1000	5	5
S-000 0	1609	5	5
8-0018	1000	5	5
8-0014	1000	5	£,
8-0015	1000	5	5
8-0016	1000	5	5
8.0034	1000	5	õ,
8-0085	1000	5	5
8-0087	1600	3	5
8-0088	1000	3	5
3-0039	1000	5	ď
3-0040	1000	5	8
3-0041	1000	8	2
3-0044	1000	5	5
3-0047	1000	5	5
8-0049	1003	6	õ
8-0051	1000	5	5
8-0054	1000	5	5
8-0059	1000	5	5
3-0060	1900	5	5
3-0061	1000	5	5
\$-0070	1000	5	5
3-0072	1000	5	5
2-0679	1609	5	5
3-0074	1000	ō	5
8-0081	1038	6	5
3-0082	1000	5	5

【0470】 【表147】



365



(184)

特闘2002-308857

365

化合物番号	菜盘(g a.i. /ba)	943t'z	:174
3-0083	1000	13	5
3-0064	1000	5	5
3-0085	1000	5	5
3-0086	1000	g	5
8-0037	1000	ð	5
8-0088	1000	ā	5
8-008 9	1000	5	5
8-0990	1000	5	5
8-0991	1000	õ	5
3-0160	1000	5	5
9-0201	1000	5	5
3-0102	1000	5	δ
8-0103	1000	ð	5
3-0114	1000	5	5
3-0115	1000	5	5
8.0117	1000	5	6
8-0118	1000	6	6
9-011 9	1000	5	6
3-0120	1000	5	6
3.0121	1000	б	6
3.0124	1000	5	5
8-0125	1000	5	5
5-0126	1000	5	5
9-0127	1000	5	5
8-0128	1000	ð	5
8.0129	1000	5	5
3-0180	1000	5	8
9-0181	1000	5	5
3·0184	1000	5	5
2-0125	1000	8	5
3-0127	1000	8	٥
3-0189	1000	ð	5
8-0144	1000	5	5
3-0153	1000	5	5
3-0156	1600	5	5
8-0160	1600	5	6
3-0173	1000	5	5
3-0174	1600	ច	6
3.0176	1009	δ	6
3.0177	1609	5	5
8.0178	1600	5	5

	# A # # B		00	- 1 14
	化合物委员	美量(g n.i. fba)		314
	3-0180	1080	5	5
	4-0001	1000	5	5
1	4-0802	1000	6	5
	4-0005	1000	5	5
	4-0007	1000	5.	5
	4-0008	1000	6	5
110	5.0001	1000	5	5
	5.0002	1000	Б	ű
	5-0003	1000	5	5
	5-09 0 5	1000	5	5
	5-0008	1000	5	ő
	B-0007	1000	5	6
	6-0003	1000	5	5
i	6-0004	1000	5	5
	7-0004	1000	5	5
	7-0006	1000	5	5
ì	7-0008	1000	5	5
	7-0009	1000	5	5
	8-0001	1000	5	5
	8.0012	1900	5	5
- 1	9-0001	1000	5	5
	9.0003	1000	5	5
	9-0005	1000	5	5
	9-0006	1000	δ	5
	9-0008	1000	š	8
	10-0002	1000	5	4
	10-0003	1000	5	3
1	10-0004	1000	5	5
	10-0002	1000	5	5
	10-0008	1000	5	5
	10-0008	1960	5	5
- 1	10-0009	1000	5	5
- 1	10-0009	1000	5	5
	10-0011	1000	8	8
	10-0012	1000	5	5
	10-0018	1000	5	ā
	10-0014	1000	-	
			5	5
	10-0016	1000	ō	5
	10-0017	1969	5	5
	10-0018	1090	5	5

【0471】 【表148】

【 0472】 〈試験例2〉 畑地土壌処理による除草効 母試験

80cm⁴プラスチックボットに細土壌を充填し、イヌビエ、エノコログサの租子を搭担して覆土した。設削例 1に導じて調製した水和剤を水で希釈し、1ヘクタール 当り有効成分が1000gになる場に、1ヘクタール当 40り1000lを小型噴霧器で土壌裏面に均一に散布した。その後、温室内で育成し、処理21日目に表145の基準に従って、除草効果を調査した。結果を表149~表152に示す。

【0473】 【表149】

367



(185)

特闘2002-308857

-	化合物器号	來量(g a.i. /he)	イスピュ	エノコログサ		化合物链号	菜量(gai/ha)	イヌピエ	エノコログキ
-	1-0001	1090	5	5		3-0850	1000	- 5	5
	1-0002	1000	5	5		3-0053	1000	8	В
	1-0003	1600	5	5		3-9954	1000	8	5
	1-0004	1000	5	5		3-0954	1000	5	5
	1-0005	1000	5	5		3-0056	1000	5	5
	L-0008	1000	5	4		3-0059	1000	5	5
	2-0001	100G	5	5		3-0060	1600	5	5
	2-0003	1000	5	5		3-0063	1608	5	5
	2-0004	1096	5	5		3-9070	1000	4	4
	2-0085	1000	5	5		3-0972	1000	5	5
	2-0086	1000	5	4		3-9073	1600	5	5
	2-0307	1000	4	4	10	3-0074	1600	6	5
- 1	2-0008	1000	5	5		3-6081	1600	5	5
1	2-0011	1000	5	4		3-0082	1000	5	5
1	2-0012	1003	5	5		3-0063	1600	5	5
	3-0002	1000	5	5		3-8084	1000	5	5
	3-0084	1800	5	5		3-0085	1000	5 -	5
ı	3-0006	1000	4	4		3-0096	1000	5	5
-	3~8068	1903	5	5		3-0087	1800	5	5
- 1	3-0009	1000	5	5		3-0068	1900	5	4
	3-8012	1900	5	5		3-0091	1000	5	5
	3-6013	1000	5	5	(3-0114	1000	5	5
	3-0015	1000	5	5		3-0115	1000	S	5
	3-0016	1900	5	5		9-0117	1000	5	5
	3-0017	3900	5	5	20	2-0118	1000	6	5
	3-0018	1900	5	5		9-0119	1080	5	5
	3-0019	1000	5	5		3-0120	1600	5	5
- 1	3-0020	1900	5	5		3-0121	1680	5	5
-1	3-0034	1000	5	5		3-0124	1090	5	5
- 1	3-0036	1000	5	5		3-0125	COOT	5	5
ı	2-8036	1000	5	5		3~0126	7000	5	5
- 1	3-8037	1000	2	5		3-0127	1080	6	5
	3-0038	1600	ត	5		8-0128	1000	5	\$
	3-0039	1000	б	5		9-0129	1600	В	\$
	3-0049	1000	5	5		3-0130	1000	5	5
	3-0641	1000	5	5		3-0131	1000	5	5
	3-0043	1000	5	5		3-0134	1000	5	5
	3-0044	1600	5	5	30	3-0135	1000	5	5
	3-0047	1000	5	5	•	5-0138	1000	5	5
	3-0048	1900	5	5		5-0157	1000	5	5
	3-0049	1000	5	5		3-0138	1080	4	S

[0474] 【表150】 [0475]

【表151】



イヌピエ エノコログラ

5

5

S 5

5

5

5

S

5

5

3

5

5 5

5

5

5

S

5

8

6

5

5

5

4

5

5

4

5

5

4

6

6

6

6

5

5

5

6

5

4

5

5

5

5

5

5

Б

8

5

5

5

5

5

5

6

В

6

Б

5

5

5

化合物番号 菜量(gai./ha)

1090

1000

1000

1000

1000

1000

1090

1060

1090

1000

1000

1060

1060

1060

1000

1060

100D

1000

1000

1000

1000

1060

1000

1060

1000

1060

1090

1000

1000

1000

1080

C001

1080

1090

1080

1080

1000

1000

1060

1060

1000

9-0189

3-0139

3-0142

8-0143

8-0144

3-0153

3-0156

3-0173

3-0174

3-0189

3-0180

4-0001

4-0001

4-0002

4-0005

4-0006

4-0007

4-0008

5-0001

5-0002

5-0003

5**-0005**

5-0008

8-0007

6-0001

6-0003

6-0004

7-0002

7-0004

7-0006

7-0007

7-0008

7-0069

8-0001

8-0004

8-0005

8-0007

9-0001

9-0005

9-0006

9-0007



(186)

特闘2002-308857

[0476] 【表152】

化合物登号	菜髮(g a.l. /ha)	イタレ エ	エノコログサ
9-0008	1000	5	5
10-0063	1000	5	5
10-0004	1000	5	5
10-0005	1600	5	5
10-0008	1000	5	4
10-0009	1000	5	5
10-0012	1000	5	4
10-0013	1600	5	5
10-0014	1000	5	5
10-0015	1000	5	5
10-0016	1600	₽.	4
10-3017	1000	5	5
10-6018	1000	5	5

【0477】 (試験例3) 畑地茎葉処理による除草効 杲試験

80 cm⁴プラスチックポットに砂を充填し、イヌビ エ. エノコログサの種子を繙種し、温室内で2週間育成 後、製剤例1に導じて調製した水和剤を水に希釈し、1 20 ヘクタール当り有効成分が1000gになる様に、1へ クタール当り10001を小型順義器で植物体の上方か ち全体に茎葉散布処理した。その後、温室内で育成し、 処理14日目に表145の基準に従って、除草効果を調 査した。 結果を表153~表154に示す。

[0478] 【表153】

10

30





372

(187)

特闘2002-308857

371

化合物替号	夏量(g a L /ba)	イヌと 'エ	X/3274
1-0001	1000	5	4
1-0004	1000	5	4
2-0001	1.000	5	4
2.6003	1000	5	4
2.6004	1000	6	4
2.0008	1000	5	ð
2-0011	1000	5	4
\$-0008	1000	4	4
3-0010	1000	. 5	4
2-0011	1000	2	4
3-0013	1000	5	5
3-0015	1000	8	4
3-0035	1000	4	4
3-0086	1000	4	4
3-0 037	1000	5	4
3.0038	1000	5	5
3.0089	1000	5	5
3.0044	1000	5	4
8-0049	1000	4	4
8-0078	1000	õ	4
3-0074	1000	5	4
3-0076	1000	5	4
3-0077	1000	5	4
3-0081	1000	4	4
3-0082	1000	4	4
3-0988	1000	4	4
3.0084	1000	. 4	4
3-0085	1000	4	4
3-0086	1000	4	4
3.0092	1600	4	4
3-0104	1000	5	4
8-0105	1000	6	4
8-0106	1000	6	4
3-0107	1000	5	Ď
8-0115	1000	5	4
3-0118	1000	5	4
3-0119	1000	5	4
3-0120	1000	5	5
3-0144	1000	В	5
4-0002	1000	5	4
4-0003	1000	5	4

[0479]

* * 【表154】

	•••	A. FREE O.	
化合物番号	築量(g a.i. fha)	/ ኧヒ ゚ エ	エノコログサ
5-0001	1000	5	4
5-0002	1000	5	5
5-0008	1000	5	4
6-0007	1000	5	5
6.0004	1000	5	4
7.0008	1000	Б	5
7.0009	1000	4	4
8-0001	1000	5	4
9-0001	1000	4	1 4
9.0005	1000	4	4
9-0008	1000	. 4	4

[0480]

【発明の効果】一般式 [I] で表される本発明の化合物

ヌタデ、アオビユ、シロザ、ハコベ、イチビ、アメリカ キンゴジカ、アメリカツノクサネム、アサガオ、オナモ

は、畑地において問題となる種々の雑草、例えばオオイ 50 ミ等の広葉雑草をはじめ、ハマスゲ、キハマスゲ、ヒメ

(188)

特闘2002-308857

373

374

クグ. カヤツリグサ、コゴメガヤツリ等の多年生および 1年生カヤツリグサ科雑草、ヒエ、メヒシバ、エノコロ グサ. スズメノカタビラ、ジョンソングラス、ノスズメ ノテッポウ、野生エンバク等のイネ科雑草の発芽前から 生育期の広い範囲にわたって優れた除草効果を発揮す る。また、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、 コナギ等の一年生雑草及びウリカワ、オモダカ、ミズガ* * ヤツリ、クログワイ、ホタルイ、ヘラオモダカ等の多年 生雑草を防除することもできる。

【0481】一方、本発明の駐草剤は作物に対する安全性も高く、中でもイネ、コムギ、オオムギ、トウモロコシ、グレインソルガム、ダイズ、ワタ、テンサイ等に対して高い安全性を示す。

フロントページの続	ž
-----------	---

(51) Int.Cl	.'	Fi	テーマコード(容考)
A 0 1 N	47/ <u>1</u> 6	C 0 7 D 251/08	
	47/38	413/12	
C 0 7 D	261/08	417/12	
	413/12	A 0 1 N 43/82	104
	417/12		102
(72)発明者	宮崎 雅弘	(72)発明者 高橋 智	
	静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1	静岡県静岡市	吉野町5番地の18
	株式会性ケイ・アイ研究所内	Fターム(参考) 4C056 AA	01 AB01 AC01 AD01 AE02
(72)発明者	角 庶一郎	AF	05 FA03 FA07
	静岡県磐田郡福田町蛭池276番地の1	4C963 AA	01 BB08 CC51 CC76 DD04
(72)発明者	兢波 周	DD	12 0029 0031 0051 EE03
	静岡県小笠郡菊川町加茂1809香地	4H011 AB	01 AB02 BA01 BB19 BB13
(72)発明者	上野 良平	BB	14 BC01 BC03 BC07 BC16
	静岡県小笠郡菊川町加茂1809香地	BC	19 BC20 DA02 DA15 DA16
		DO	01 DC05 DC06 DC08 DD01
	·	DD	03 DH03

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

□ BLACK BORDERS
□ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
□ FADED TEXT OR DRAWING
□ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
□ SKEWED/SLANTED IMAGES

☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT	
☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY	7

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

OTHER:

☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

☐ GRAY SCALE DOCUMENTS

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.